

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
18. August 2005 (18.08.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/074686 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **A01N 43/56**,
C07D 231/16, 231/14

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/000633

(22) Internationales Anmeldedatum:
22. Januar 2005 (22.01.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102004005787.7 6. Februar 2004 (06.02.2004) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): **BAYER CROPSCIENCE AKTIENGE-
SELLSCHAFT** [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789
Monheim (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **DUNKEL, Ralf**

[DE/DE]; Krischer Str. 22, 40789 Monheim (DE). **ELBE, Hans-Ludwig** [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wuppertal (DE). **HARTMANN, Benoit** [FR/DE]; Färberstr. 1, 40764 Langenfeld (DE). **GREUL, Jörg, Nico** [DE/DE]; Am Sandberg 30 a, 42799 Leichlingen (DE). **HERRMANN, Stefan** [DE/DE]; Virneburgstr. 4 a, 40764 Langenfeld (DE). **WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike** [DE/DE]; Oberer Markenweg 85, 56566 Neuwied (DE). **DAHMEN, Peter** [DE/DE]; Altebrückerstr. 61, 41470 Neuss (DE). **KUCK, Karl-Heinz** [DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 30 a, 40764 Langenfeld (DE).

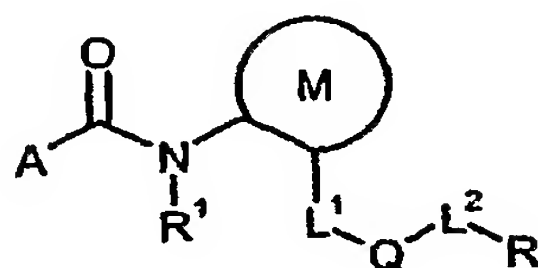
(74) Gemeinsamer Vertreter: **BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT**; Business Planning and Administration, Law and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,

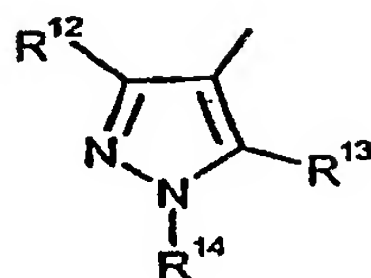
[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: N-(2-(HYDROXYMETHYL) PHENYL)-1H-PYRAZOLE-4-CARBOXAMIDE DERIVATIVES AND RELATED COMPOUNDS AS MICROBICIDAL ACTIVE INGREDIENTS FOR PHYTO-PROTECTION AND THE PROTECTION OF MATERIALS

(54) Bezeichnung: N-(2- (HYDROXYMETHYL) PHENYL) -1H-PYRAZOL-4-CORBOXAMID DERIVATE UND VERWANDTE VERBINDUNGEN ALS MIKROBIZIDE WIRKSTOFFE ZUR ANWENDUNG IM PFLANZEN- UND MATERIALSCHUTZ



(I)



(AI)

(57) Abstract: The invention relates to novel carboxamides of formula (I), in which M represents a phenyl ring, pyridine ring or pyrimidine, pyridazine or pyrazine ring, respectively monosubstituted by R⁸, or represents a thiazole ring substituted by R^{8-A}; R⁸ represents hydrogen, fluorine, chlorine, methyl, isopropyl, methylthio or

trifluoromethyl; R⁸ can also represent methoxy; R^{8-A} represents hydrogen, methyl, methylthio or trifluoromethyl; L¹ represents C₁-C₁₀ alkene (alkanediyl); Q represents O, S, SO, SO₂ or NR⁹; L² represents a direct bond, SiR¹⁰R¹¹ or CO; R represents hydrogen, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₄ alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkynyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆- haloalkenyl, C₂-C₆ haloalkynyl or C₃-C₆ cycloalkyl; A represents the group of formula (AI); the remaining substituents are defined in claim 1. The inventive substances have a powerful microbicidal action and can be used to control undesirable micro-organisms such as fungi and bacteria in the phyto-protection and material protection fields.

(57) Zusammenfassung: Neue Carboxamide der Formel (1), in welcher M für einen jeweils einfach durch R⁸ substituierten Phenyl-, Pyridin- oder Pyrimidin-, Pyridazin oder Pyrazin-Ring oder für einen durch R^{8-A} substituierten Thiazol-Ring steht, R⁸ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht, R⁸ ausserdem für Methoxy steht, R^{8-A} für Wasserstoff, Methyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht, L¹ für C₁-C₁₀-Alkylen (Alkandiyl) steht, Q für O, S, SO, SO₂ oder NR⁹ steht, L² für eine direkte Bindung, SiR¹⁰R¹¹ oder CO steht, R für Wasserstoff, C₁-C₈ Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ Alkylthio-C₁ C₄-alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆- Halogenalkenyl, C₂-C₆-Halogenalkynyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl steht, A für den Rest der Formel (A 1) steht. Die anderen Substituenten sind in Anspruch 1 definiert; Die erfindungsgemässen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

WO 2005/074686 A1



CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,

TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

N-(2-(HYDROXYMETHYL)PHENYL)-1H-PYRAZOL-4-CARBOXAMID DERIVATE UND VERWANDTE VERBINDUNGEN ALS MIKROBIZIDE WIRKSTOFFE ZUR ANWENDUNG IM PFLANZEN- UND MATERIALSCHUTZ

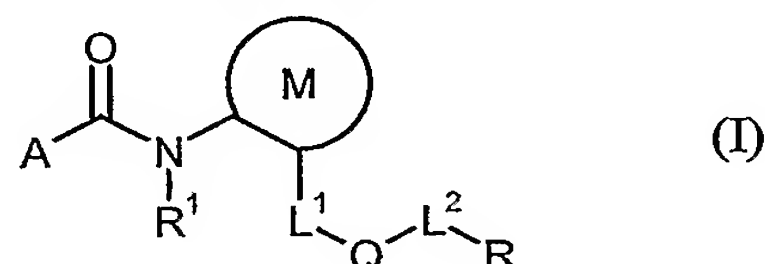
Die vorliegende Erfindung betrifft neue Carboxamide, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

5

Es ist bereits bekannt, dass zahlreiche Carboxamide fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. z.B. WO 03/010149, WO 02/059086, EP-A 0 824 099, EP-A 0 737 682, EP-A 0 591 699, EP-A 0 589 301, EP-A 0 545 099, DE-A 24 09 011, DE-A 20 06 472, JP-A 2001-302605, JP-A 10-251240, JP-A 8-176112, JP-A 8-92223 und JP-A 53-72823). So sind bereits zahlreiche Alkylcarboxamide bekannt geworden, die im Alkylteil nicht substituiert sind, wie beispielsweise N-Allyl-N-[2-(1,3-dimethylbutyl)phenyl]-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid aus WO 02/059086, N-[2-(1,3-Dimethylbutyl)phenyl]-2,4-dimethyl-1,3-thiazol-5-carboxamid aus EP-A 0 824 099 und 5-Fluor-1,3-dimethyl-N-[2-(1,3,3-trimethylbutyl)phenyl]-1H-pyrazol-4-carboxamid aus WO 03/010149. Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber in manchen Fällen, z.B. bei niedrigen Aufwandmengen zu wünschen übrig.

15

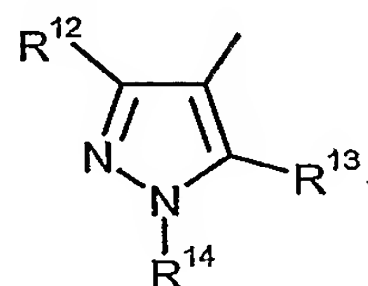
Es wurden nun neue Carboxamide der Formel (I)



gefunden, in welcher

- R^1 für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl; C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- C_1 - C_3 -alkyl, (C_1 - C_3 -Alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, (C_1 - C_3 -Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl; Halogen-(C_1 - C_3 -alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, Halogen-(C_1 - C_3 -alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
- (C_1 - C_8 -Alkyl)carbonyl, (C_1 - C_8 -Alkoxy)carbonyl, (C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl)carbonyl, (C_3 - C_8 -Cycloalkyl)carbonyl; (C_1 - C_6 -Halogenalkyl)carbonyl, (C_1 - C_6 -Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen- C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl)carbonyl, (C_3 - C_8 -Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ oder $-CH_2NR^5R^6$ steht,
- R^2 für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl; C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, Halogen- C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,
- R^3 und R^4 unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl; C_1 - C_8 -Halogenalkyl, Halogen- C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Halogen-

- cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- R^3 und R^4 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^7 enthalten kann,
- R^5 und R^6 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl; C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_3 - C_8 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- R^5 und R^6 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^7 enthalten kann,
- R^7 für Wasserstoff oder C_1 - C_6 -Alkyl steht,
- M für einen jeweils einfach durch R^8 substituierten Phenyl-, Pyridin- oder Pyrimidin-, Pyridazin oder Pyrazin-Ring oder für einen durch R^{8-A} substituierten Thiazol-Ring steht,
- R^8 für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,
- R^8 außerdem für Methoxy steht,
- R^{8-A} für Wasserstoff, Methyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,
- L^1 für C_1 - C_{10} -Alkylen (Alkandiyl) steht,
- Q für O, S, SO, SO_2 oder NR^9 steht,
- L^2 für eine direkte Bindung, $SiR^{10}R^{11}$ oder CO steht,
- R für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkinyl oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl steht,
- R^9 für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkinyl oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl steht,
- R^{10} und R^{11} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl oder C_1 - C_6 -Halogenalkyl stehen,
- A für den Rest der Formel (A1)



(A1) steht, in welcher

- R^{12} für Wasserstoff, Cyano, Halogen, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy oder C_1 - C_4 -Halo-

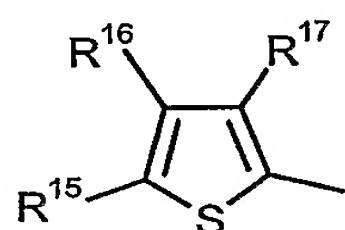
genalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, Aminocarbonyl oder Aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl steht,

R¹³ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkylthio steht,

5 R¹⁴ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, oder Phenyl steht,

oder

10 A für den Rest der Formel (A2)



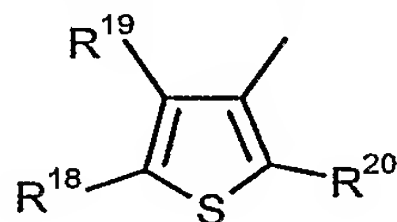
(A2) steht, in welcher

R¹⁵ und R¹⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

15 R¹⁷ für Halogen, Cyano oder C₁-C₄-Alkyl, oder C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A3)



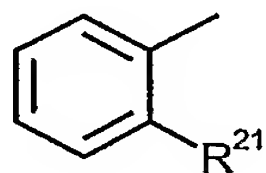
(A3) steht, in welcher

20 R¹⁸ und R¹⁹ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R²⁰ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)



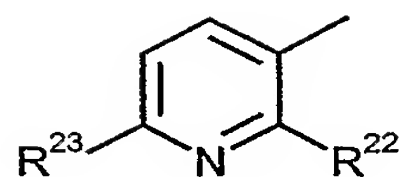
(A4) steht, in welcher

25

R²¹ für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)



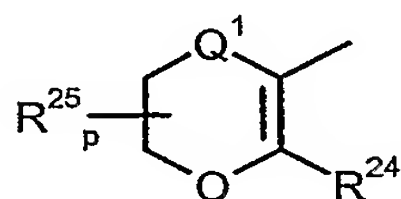
(A5) steht, in welcher

R²² für Halogen, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

5 R²³ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, C₁-C₄-Alkylsulphinyl oder C₁-C₄-Alkylsulphonyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A6)



(A6) steht, in welcher

10

R²⁴ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

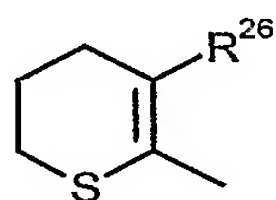
R²⁵ für C₁-C₄-Alkyl steht,

Q¹ für S (Schwefel), SO, SO₂ oder CH₂ steht,

15 p für 0, 1 oder 2, wobei R²⁵ für identische oder verschiedene Reste steht, wenn p für 2 steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)

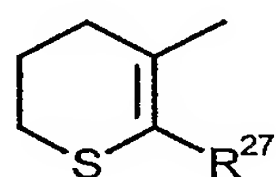


(A7) steht, in welcher

R²⁶ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

20 oder

A für den Rest der Formel (A8)

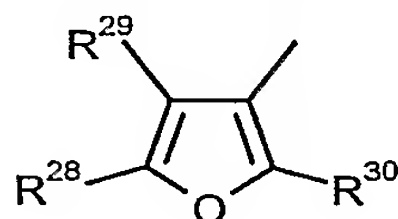


(A8) steht, in welcher

R²⁷ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

25 A für den Rest der Formel (A9)



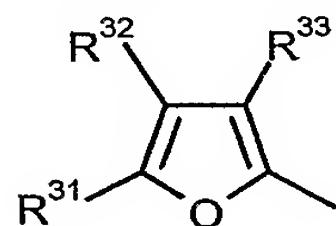
(A9) steht, in welcher

R^{28} und R^{29} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen,

R^{30} für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

5 oder

A für den Rest der Formel (A10)



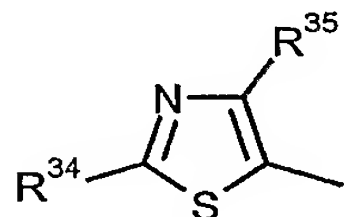
(A10) steht, in welcher

R^{31} und R^{32} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen,

10 R^{33} für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



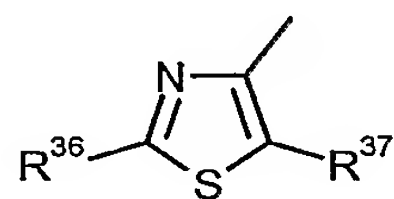
(A11) steht, in welcher

15 R^{34} für Wasserstoff, Halogen, Amino, C_1 - C_4 -Alkylamino, Di- $(C_1$ - C_4 -alkyl)amino, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{35} für Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A12)



(A12) steht, in welcher

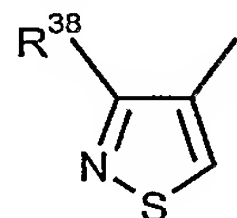
20

R^{36} für Wasserstoff, Halogen, Amino, C_1 - C_4 -Alkylamino, Di- $(C_1$ - C_4 -alkyl)amino, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{37} für Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

25 A für den Rest der Formel (A13)

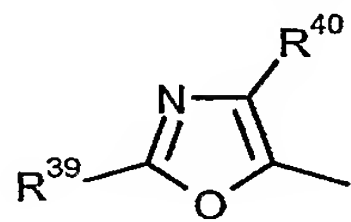


(A13) steht, in welcher

R^{38} für Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A14)



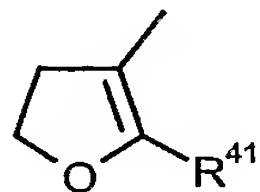
(A14) steht, in welcher

R³⁹ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl steht,

R⁴⁰ für Halogen oder C₁-C₄-Alkyl steht,

5 oder

A für den Rest der Formel (A15)

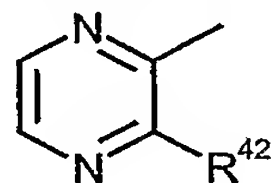


(A15) steht, in welcher

R⁴¹ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

10 A für den Rest der Formel (A16)

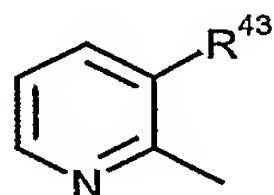


(A16) steht, in welcher

R⁴² für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

15 A für den Rest der Formel (A17)

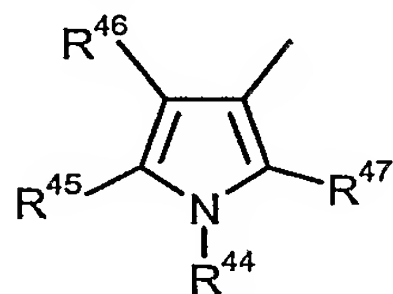


(A17) steht, in welcher

R⁴³ für Halogen, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

20 oder

A für den Rest der Formel (A18)



(A18) steht, in welcher

R⁴⁴ für Wasserstoff, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Di(C₁-C₄-alkyl)aminosulfonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylsulfonyl oder Benzoyl steht,

25

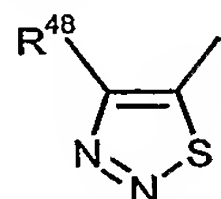
R^{45} für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{46} für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

5 R^{47} für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A19)



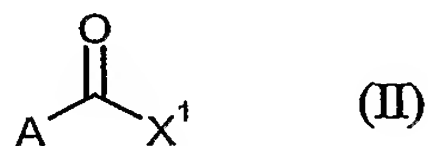
(A19) steht, in welcher

10 R^{48} für C_1 - C_4 -Alkyl steht,

wobei R nicht für Alkoxy steht, wenn L^2 für eine direkte Bindung steht.

Weiterhin wurde gefunden, dass man Carboxamide der Formel (I) erhält, indem man

(a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)



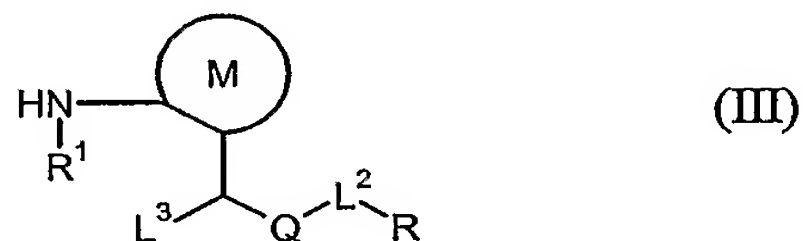
15

in welcher

A die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X^1 für Halogen oder Hydroxy steht,

mit Anilin-Derivaten der Formel (III)



20

in welcher

R^1 , M, Q, L^2 und R die oben angegebenen Bedeutungen haben,

L^3 für Wasserstoff oder C_1 - C_9 -Alkyl steht,

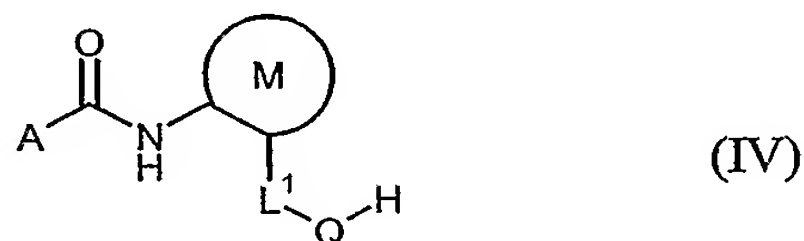
gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Konden-

25 sationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in

Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

(b) Carboxamide der Formel (IV)



(IV)

in welcher M, L¹, Q und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,
mit einer Verbindung der Formel (V)



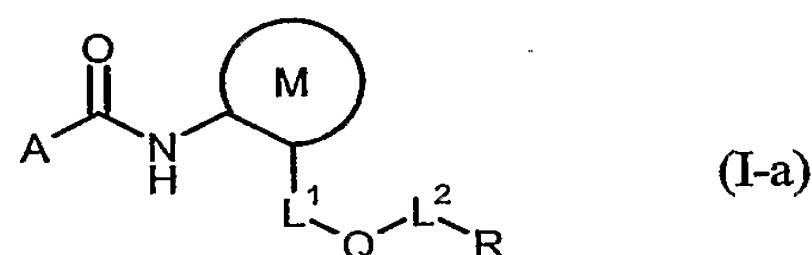
in welcher

- 5 L² und R die oben angegebenen Bedeutungen haben,
Y für Halogen, Triflat (Trifluormethylsulfonyl), Mesylat (Methylsulfonyl) oder Tosylat
(4-Methylphenylsulfonyl) steht,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder

- 10 (c) Carboxamide der Formel (I-a)



in welcher M, L¹, Q, L², R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,
mit Halogeniden der Formel (VI)



- 15 in welcher

X² für Chlor, Brom oder Iod steht,

- 20 R^{1-A} für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; (C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogenocycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R², -CONR³R⁴ oder -CH₂NR⁵R⁶ steht,
wobei R², R³, R⁴, R⁵ und R⁶ die oben angegebenen Bedeutungen haben,
30 in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

Schließlich wurde gefunden, dass die neuen Carboxamide der Formel (I) sehr gute mikrobizide Eigenschaften besitzen und zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen sowohl im Pflanz-

zenschutz als auch im Materialschutz verwendbar sind.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z. B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, gegebenenfalls aber auch von Tautomeren vorliegen. Es werden sowohl die E- als auch die Z-Isomeren, wie auch die threo- und erythro-, sowie die optischen Isomeren, beliebige Mischungen dieser Isomeren, sowie die möglichen tautomeren Formen beansprucht.

Die erfindungsgemäßen Carboxamide sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugte Restdefinitionen der vorstehenden und nachfolgend genannten Formeln sind im Folgenden angegeben. Diese Definitionen gelten für die Endprodukte der Formel (I) wie für alle Zwischenprodukte gleichermaßen.

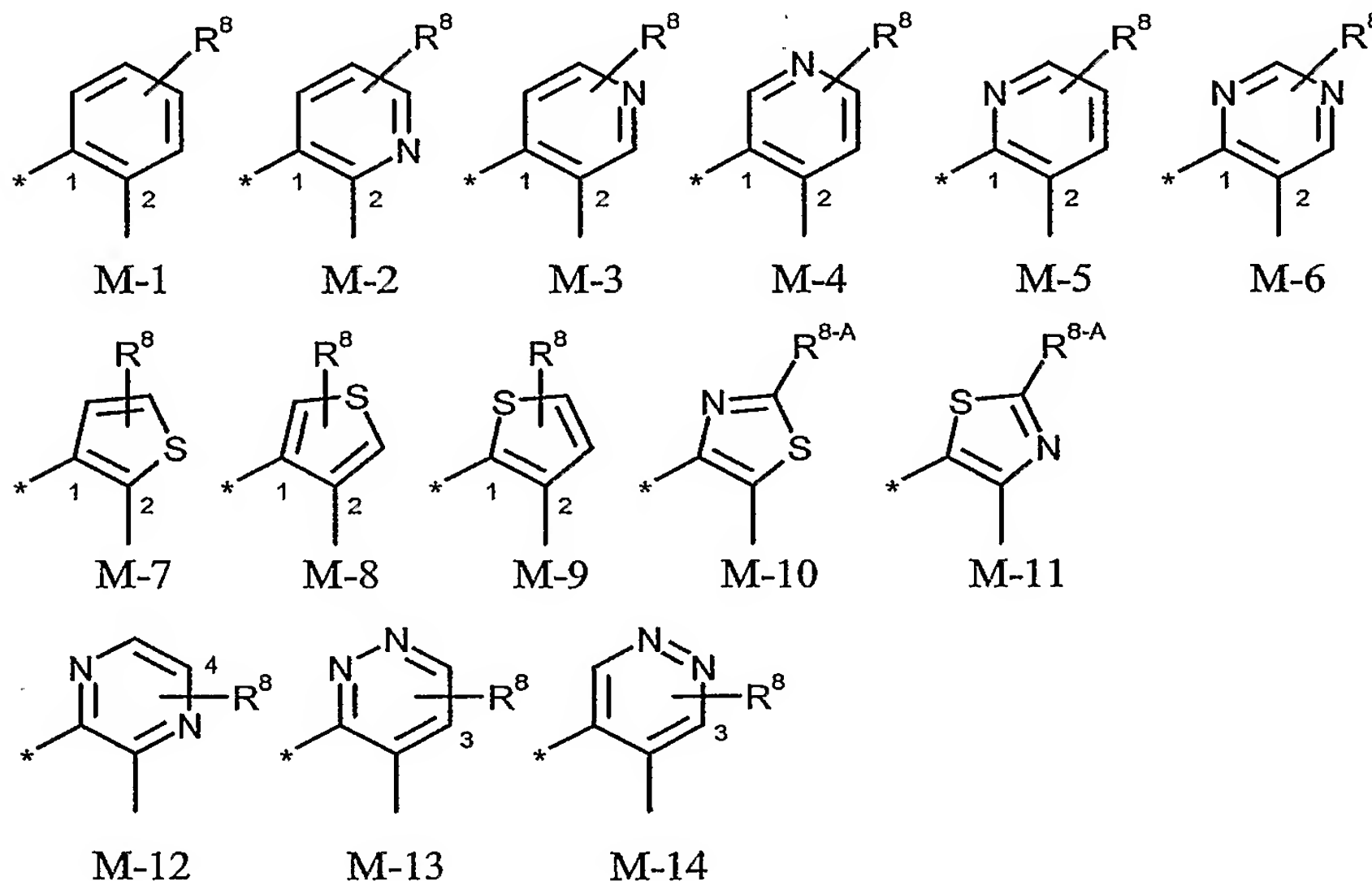
R^1 steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_8 -Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- C_1 - C_3 -alkyl, $(C_1$ - C_3 -Alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, $(C_1$ - C_3 -Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl; Halogen- $(C_1$ - C_3 -alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, Halogen- $(C_1$ - C_3 -alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; $(C_1$ - C_6 -Alkyl)carbonyl, $(C_1$ - C_4 -Alkoxy)carbonyl, $(C_1$ - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl)carbonyl, $(C_3$ - C_6 -Cycloalkyl)carbonyl; $(C_1$ - C_4 -Halogenalkyl)carbonyl, $(C_1$ - C_4 -Halogenalkoxy)carbonyl, $(\text{Halogen-}C_1$ - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl)carbonyl, $(C_3$ - C_6 -Halogen-cycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ oder $-CH_2NR^5R^6$.

R^1 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO-CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO-CF_3$, $-CH_2-CO-CCl_3$, $-CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CCl_3$,

- CH₂-CO₂CH₂CF₃, -CH₂-CO₂CF₂CF₃, -CH₂-CO₂CH₂CCl₃, -CH₂-CO₂CCl₂CCl₃,
 -(CH₂)₂-CO₂CH₂CF₃, -(CH₂)₂-CO₂CF₂CF₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO₂CCl₂CCl₃;
 Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl,
 Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluorme-
 5 thylcarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, oder -C(=O)C(=O)R², -CONR³R⁴ oder -CH₂NR⁵R⁶.
- R¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Methoxymethyl, Formyl, -CH₂-CHO,
 -(CH₂)₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -C(=O)CHO,
 -C(=O)C(=O)CH₃, -C(=O)C(=O)CH₂OCH₃, -C(=O)CO₂CH₃, -C(=O)CO₂CH₂CH₃.
- 10 R² steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-
 C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-
 alkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- R² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, tert-Butyl,
 Methoxy, Ethoxy, n- oder iso-Propoxy, tert-Butoxy, Methoxymethyl, Cyclopropyl; Trifluor-
 15 methyl, Trifluormethoxy.
- R³ und R⁴ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-
 C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-
 Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- 20 R³ und R⁴ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt
 einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder
 C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen, wobei der
 Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff,
 Schwefel oder NR⁷ enthalten kann.
- 25 R³ und R⁴ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-
 oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl,
 Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl,
 Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl.
- R³ und R⁴ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders
 30 bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor,
 Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin,
 Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R⁷ sub-
 stituiert sein kann.
- R⁵ und R⁶ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl;
 35 C₁-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder
 Bromatomen.

- 5 R^5 und R^6 bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^7 enthalten kann.
- R^5 und R^6 stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl.
- 10 R^5 und R^6 bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R^7 substituiert sein kann.
- 15 R^7 steht bevorzugt für Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl.
- R^7 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl.

- 20 M steht bevorzugt für einen der folgenden Cyclen



wobei die mit „*“ markierte Bindung mit dem Amid verknüpft ist.

- 25 M steht besonders bevorzugt für einen Cyclus ausgewählt aus M-1, M-2, M-3, M-6, M-7, M-10 oder M-11.

- M steht außerdem besonders bevorzugt für eine Cyclus ausgewählt aus M-1, M-2, M-3, M-4, M-5, M-6 oder M-10, M-11.
- M steht ganz besonders bevorzugt für den Cyclus M-1.
- M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-2.
- 5 M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-3.
- M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-6.
- M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-7.
- M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-10.
- M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-11.
- 10
- R⁸ steht bevorzugt für Wasserstoff.
- R⁸ steht für den Fall, dass M für M-1 steht, außerdem bevorzugt für Fluor, wobei Fluor besonders bevorzugt in 4-, 5- oder 6-Position, ganz besonders bevorzugt in 4- oder 6-Position, insbesondere in 4-Position steht.
- 15 R⁸ steht für den Fall, dass M für M-1 steht, außerdem bevorzugt für Chlor, wobei Chlor besonders bevorzugt in 4- oder 6-Position steht.
- R⁸ steht für den Fall, dass M für M-1 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 3-Position und außerdem besonders bevorzugt in 4-Position steht.
- R⁸ steht für den Fall, dass M für M-1 steht, außerdem bevorzugt für Methoxy, wobei Methoxy
- 20 besonders bevorzugt in 4-Position steht.
- R⁸ steht für den Fall, dass M für M-1 steht, außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl besonders bevorzugt in 4- oder 6-Position steht.
- R⁸ steht für den Fall, dass M für M-2, M-3, M-4 oder M-5 steht, außerdem bevorzugt für Fluor, wobei Fluor besonders bevorzugt in 6-Position (M-2, M-3) oder in 3-Position (M-4, M-5) steht.
- 25 R⁸ steht für den Fall, dass M für M-2, M-3, M-4 oder M-5 steht, außerdem bevorzugt für Chlor, wobei Chlor besonders bevorzugt in 6-Position (M-2, M-3) oder in 3-Position (M-4, M-5) steht.
- R⁸ steht für den Fall, dass M für M-2, M-3, M-4 oder M-5 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 4-Position (M-2) oder in 3-Position (M-3, M-4, M-5) steht.
- 30 R⁸ steht für den Fall, dass M für M-6 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.
- R⁸ steht für den Fall, dass M für M-6 steht, außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.
- R⁸ steht für den Fall, dass M für M-7, M-8 oder M-9 steht, außerdem bevorzugt für Chlor, wobei
- 35 Chlor besonders bevorzugt in 5-Position (M-7, M-8) oder in 3-Position (M-9) steht.

- R⁸ steht für den Fall, dass M für M-7, M-8 oder M-9 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 5-Position (M-7, M-8) oder in 3-Position (M-9) steht.
- R⁸ steht für den Fall, dass M für M-12 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 4-Position steht.
- 5 R⁸ steht für den Fall, dass M für M-12 steht, außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Tri-
fluormethyl besonders bevorzugt in 4-Position steht.
- R⁸ steht für den Fall, dass M für M-13 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.
- R⁸ steht für den Fall, dass M für M-13 steht, außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Tri-
10 fluormethyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.
- R⁸ steht für den Fall, dass M für M-14 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.
- R⁸ steht für den Fall, dass M für M-14 steht, außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Tri-
fluormethyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.
- 15
- R^{8-A} steht bevorzugt für Wasserstoff.
- R^{8-A} steht außerdem bevorzugt für Methyl.
- R^{8-A} steht außerdem bevorzugt für Trifluormethyl.
- 20 L¹ steht bevorzugt für C₁-C₆-Alkylen (Alkandiyl).
- L¹ steht besonders bevorzugt für -CH₂-, -CH(CH₃)- oder -(CH₂)₂C(CH₃)₂-.
- L¹ steht außerdem besonders bevorzugt für -(CH₂)₂-.
- Q steht bevorzugt für O.
- 25 Q steht außerdem bevorzugt für S.
- Q steht außerdem bevorzugt für SO.
- Q steht außerdem bevorzugt für SO₂.
- Q steht außerdem bevorzugt für NR⁹, besonders bevorzugt für NH.
- 30 L² steht bevorzugt für eine direkte Bindung.
- L² steht außerdem bevorzugt für SiR¹⁰R¹¹.
- L² steht außerdem bevorzugt für CO.
- R steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₁-
35 C₃-Alkylthio-C₁-C₃-alkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl.
- R steht außerdem bevorzugt für C₁-C₄-Halogenalkyl.

- R steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, sec-, iso- oder tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder iso-Propoxy, n-, sec-, iso- oder tert-Butoxy, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methylthiomethyl, Ethylthiomethyl, Methylthioethyl, Ethylthioethyl oder Cyclopropyl.
- 5 R steht außerdem besonders bevorzugt für 1-Methylbutyl, C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- oder Bromatomen, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.
- R steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, iso- oder tert-Butyl, Methoxy, iso-Propoxy, iso- oder tert-Butoxy, Methoxymethyl oder Methylthiomethyl.
- 10 R steht außerdem ganz besonders bevorzugt für sec-Butyl, 1-Methylbutyl, Dichlormethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.
- R steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, iso- oder tert-Butyl, Methoxy, iso-Propoxy, iso- oder tert-Butoxy.
- R steht außerdem insbesondere bevorzugt für sec-Butyl oder 1-Methylbutyl.
- 15 R⁹ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₁-C₃-Alkylthio-C₁-C₃-alkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl.
- R⁹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, sec-, iso- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methylthiomethyl, Ethylthiomethyl, Methylthioethyl, Ethylthioethyl oder Cyclopropyl.
- 20 R⁹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, iso- oder tert-Butyl, Methoxymethyl oder Methylthiomethyl.
- R⁹ steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl.
- 25 R¹⁰ und R¹¹ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl oder C₁-C₃-Alkylthio-C₁-C₃-alkyl.
- R¹⁰ und R¹¹ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methylthiomethyl, Ethylthiomethyl, Methylthioethyl oder Ethylthioethyl.
- 30 R¹⁰ und R¹¹ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Methyl, Methoxy, Methoxymethyl oder Methylthiomethyl.
- R¹⁰ und R¹¹ stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Methyl.
- 35 A steht bevorzugt für einen der Reste A1, A2, A3, A4, A5, A6, A9, A10, A11, A12, A17 oder A18.
- A steht besonders bevorzugt für einen der Reste

- A1, A2, A4, A5, A6, A9, A11, A16, A17, A18.
- A ganz besonders bevorzugt für den Rest A1.
- A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A2.
- A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A4.
- 5 A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A5.
- A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A6.
- A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A9.
- A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A11.
- A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A16.
- 10 A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A18.
- R¹² steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Cyclopropyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Aminocarbonyl, Aminocarbonylmethyl oder Aminocarbonylethyl.
- 15 R¹² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Monofluormethyl, Monofluorethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Dichlormethyl, Cyclopropyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethylthio oder Difluormethylthio.
- R¹² steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, iso-Propyl, Monofluormethyl, Monofluorethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 20 R¹² steht insbesondere bevorzugt für Methyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder 1-Fluorethyl.
- R¹³ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio oder Ethylthio.
- 25 R¹³ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod oder Methyl.
- R¹³ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Methyl.
- R¹⁴ steht bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder Phenyl.
- 30 R¹⁴ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl oder Phenyl.
- R¹⁴ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Trifluormethyl oder Phenyl.
- 35 R¹⁴ steht insbesondere bevorzugt für Methyl.

- R¹⁵ und R¹⁶ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R¹⁵ und R¹⁶ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 5 R¹⁵ und R¹⁶ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.
- R¹⁵ und R¹⁶ stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.
- R¹⁷ steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-
10 C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R¹⁷ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy oder Trichlormethoxy.
- R¹⁷ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy.
- 15 R¹⁷ steht insbesondere bevorzugt für Methyl.
- R¹⁸ und R¹⁹ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R¹⁸ und R¹⁹ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor,
20 Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R¹⁸ und R¹⁹ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.
- R¹⁸ und R¹⁹ stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.
- 25 R²⁰ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R²⁰ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl oder Trifluormethyl.
- 30 R²⁰ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl.
- R²¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 35 R²¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Difluormethyl, Trifluor-

methyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trichlormethoxy, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio oder Trichlormethylthio.

- 5 R^{21} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.
- R^{21} steht insbesondere bevorzugt für Iod, Methyl, Difluormethyl oder Trifluormethyl.
- 10 R^{22} steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C_1 - C_2 -Halogenalkyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R^{22} steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy oder Trichlormethoxy.
- 15 R^{22} steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 20 R^{23} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, C_1 - C_2 -Halogenalkyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, C_1 - C_2 -Alkylsulphinyl oder C_1 - C_2 -Alkylsulphonyl.
- R^{23} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trichlormethoxy, Methylsulphinyl oder Methylsulphonyl.
- 25 R^{23} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Methylsulphinyl oder Methylsulphonyl.
- R^{23} steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff.
- 30 R^{24} steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R^{24} steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 35 R^{25} steht bevorzugt für Methyl oder Ethyl.

- R²⁵ steht besonders bevorzugt für Methyl.
- Q¹ steht bevorzugt für S (Schwefel), SO₂ oder CH₂.
- Q¹ steht besonders bevorzugt für S (Schwefel) oder CH₂.
- 5 Q¹ steht ganz besonders bevorzugt für S (Schwefel).
- p steht bevorzugt für 0 oder 1.
- p steht besonders bevorzugt für 0.
- 10 R²⁶ steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R²⁶ steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R²⁶ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 15 R²⁷ steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R²⁷ steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 20 R²⁷ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R²⁸ und R²⁹ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 25 R²⁸ und R²⁹ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R²⁸ und R²⁹ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 30 R²⁸ und R²⁹ stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.
- R³⁰ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R³⁰ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 35

- R^{30} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R^{30} steht insbesondere bevorzugt für Methyl.
- 5 R^{31} und R^{32} stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Nitro, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R^{31} und R^{32} stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 10 R^{31} und R^{32} stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R^{31} und R^{32} stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.
- R^{33} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen,
- 15 R^{33} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R^{33} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 20 R^{33} steht insbesondere bevorzugt für Methyl.
- R^{34} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C_1 - C_4 -Alkylamino, Di(C_1 - C_4 -alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 25 R^{34} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Cyano, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R^{34} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 30 R^{34} steht insbesondere bevorzugt für Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl oder Trifluormethyl.
- R^{35} steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 35 R^{35} steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

- R^{35} steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R^{35} steht insbesondere bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl oder Difluormethyl.
- 5 R^{36} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C_1 - C_4 -Alkylamino, Di(C_1 - C_4 -alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R^{36} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Cyano, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 10 R^{36} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R^{36} steht insbesondere bevorzugt für Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl oder Trifluormethyl.
- 15 R^{37} steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R^{37} steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 20 R^{37} steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R^{37} steht insbesondere bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl oder Difluormethyl.
- R^{38} steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 25 R^{38} steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R^{38} steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 30 R^{39} steht bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl.
- R^{39} steht besonders bevorzugt für Methyl.
- R^{40} steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl,
- 35 R^{40} steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor oder Methyl.

- R⁴¹ steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R⁴¹ steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 5 R⁴¹ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R⁴¹ steht insbesondere bevorzugt für Methyl oder Trifluormethyl.
- R⁴² steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 10 R⁴² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl.
- R⁴³ steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 15 R⁴³ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R⁴³ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 20 R⁴⁴ steht bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₂-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Methylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.
- R⁴⁴ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Hydroxymethyl oder Hydroxyethyl.
- 25 R⁴⁴ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl oder Methoxymethyl.
- R⁴⁵ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- 30 R⁴⁵ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R⁴⁵ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl.
- R⁴⁶ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- 35

R^{46} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{46} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Difluormethyl oder Trifluormethyl.

5 R^{47} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{47} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl oder Trifluormethyl.

R^{47} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff.

10

R^{48} steht bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder iso-Propyl.

R^{48} steht besonders bevorzugt Methyl oder Ethyl.

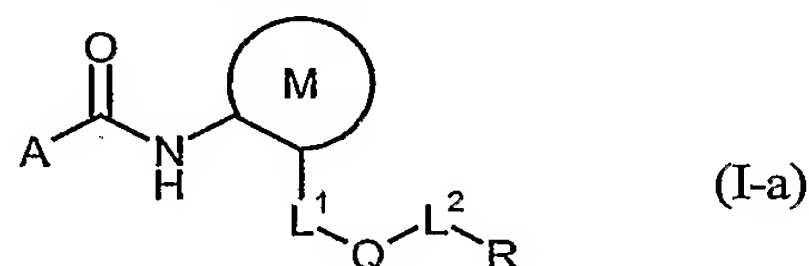
15

Bevorzugt sind solche Verbindungen der Formel (I), in welcher alle Reste jeweils die oben genannten bevorzugten Bedeutungen haben.

Besonders bevorzugt sind solche Verbindungen der Formel (I), in welcher alle Reste jeweils die oben genannten besonders bevorzugten Bedeutungen haben.

20 Bevorzugt und jeweils als Teilmenge der oben genannten Verbindungen der Formel (I) zu verstehen sind folgende Gruppen von neuen Carboxamiden:

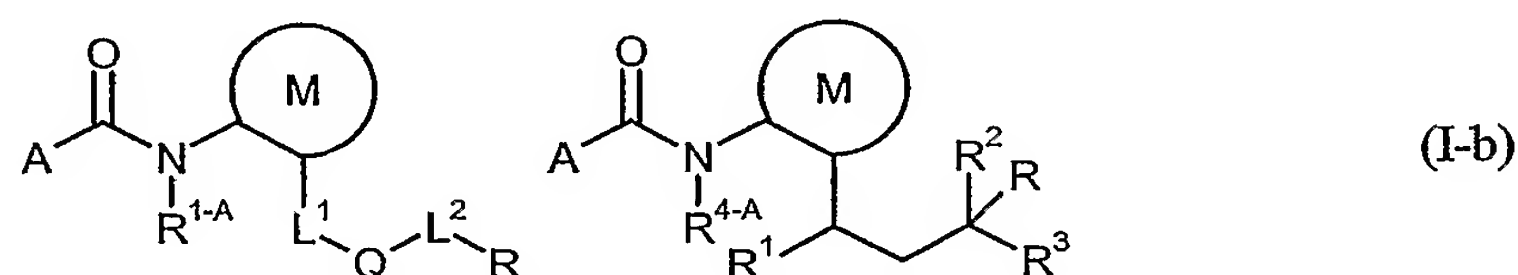
Gruppe 1: Carboxamide der Formel (I-a)



25

in welcher M, L^1 , Q, L^2 , R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Gruppe 2: Carboxamide der Formel (I-b)

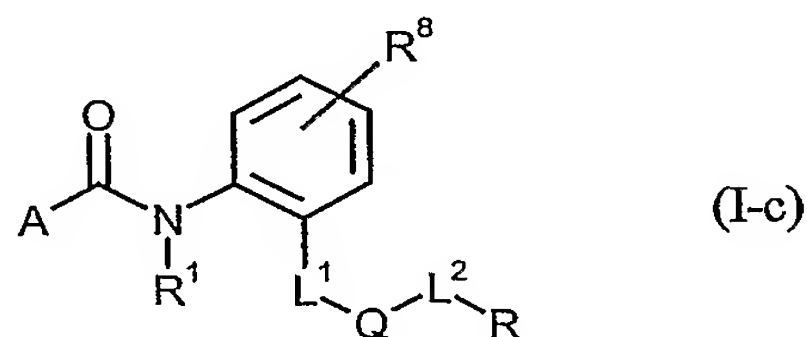


in welcher R^{1-A} , M, L^1 , Q, L^2 , R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

30

- R^{1-A} steht bevorzugt für C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_8 -Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- C_1 - C_3 -alkyl, (5) C_1 - C_3 -Alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
- (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Halogen-cycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ oder $-CH_2NR^5R^6$.
- R^{1-A} steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Di-15 fluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO-CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO-CF_3$, $-CH_2-CO-CCl_3$, $-CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CCl_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CF_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-CH_2-CO_2CCl_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CF_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CCl_2CCl_3$; 20
- Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluormethylcarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, oder $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ oder $-CH_2NR^5R^6$.
- R^{1-A} steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Methoxymethyl, Formyl, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-C(=O)CHO$, $-C(=O)C(=O)CH_3$, $-C(=O)C(=O)CH_2OCH_3$, $-C(=O)CO_2CH_3$, $-C(=O)CO_2CH_2CH_3$. 30

Gruppe 3: Carboxamide der Formel (I-c)



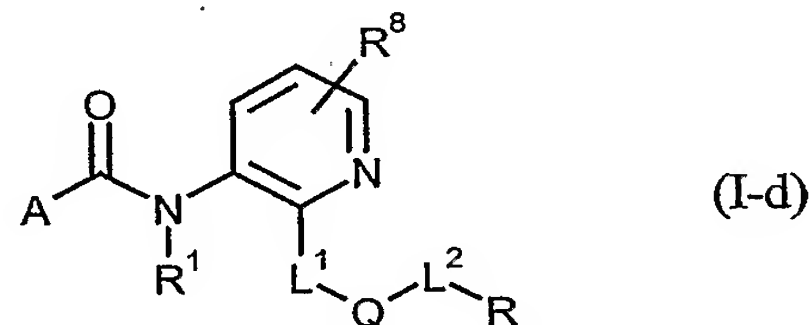
in welcher R^1 , R^8 , L^1 , Q , L^2 , R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-c), in welcher R^1 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-c), in welcher R^8 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-c), in welcher R^1 und R^8 jeweils für Wasserstoff stehen.

5 Gruppe 4: Carboxamide der Formel (I-d)



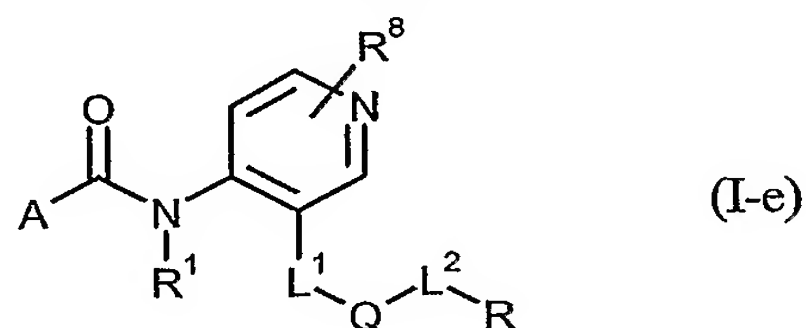
in welcher R^1 , R^8 , L^1 , Q , L^2 , R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-d), in welcher R^1 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-d), in welcher R^8 für Wasserstoff steht.

10 Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-d), in welcher R^1 und R^8 jeweils für Wasserstoff stehen.

Gruppe 5: Carboxamide der Formel (I-e)



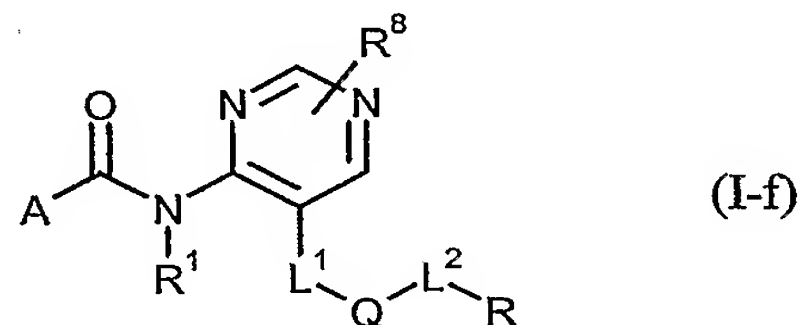
in welcher R^1 , R^8 , L^1 , Q , L^2 , R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

15 Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-e), in welcher R^1 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-e), in welcher R^8 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-e), in welcher R^1 und R^8 jeweils für Wasserstoff stehen.

Gruppe 6: Carboxamide der Formel (I-f)



20

in welcher R^1 , R^8 , L^1 , Q , L^2 , R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

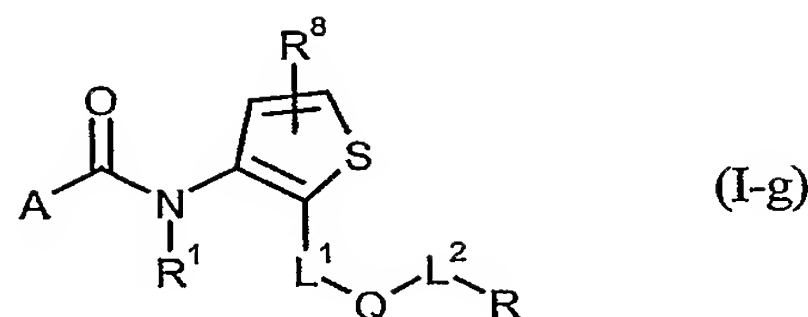
Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-f), in welcher R^1 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-f), in welcher R^8 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-f), in welcher R^1 und R^8 jeweils für Wasserstoff stehen.

25

Gruppe 7: Carboxamide der Formel (I-g)



in welcher R^1 , R^8 , L^1 , Q , L^2 , R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-g), in welcher R^1 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-g), in welcher R^8 für Wasserstoff steht.

5 Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-g), in welcher R^1 und R^8 jeweils für Wasserstoff stehen.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I) (und ebenso der Gruppen 1 bis 7), in welcher R^1 für Wasserstoff steht.

10 Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I) (und ebenso der Gruppen 1 bis 7), in welcher R^1 für Formyl steht.

Hervorgehoben sind außerdem Verbindungen der Formel (I) (und ebenso der Gruppen 1 bis 7), in welcher R^1 für $-C(=O)C(=O)R^2$ steht, wobei R^2 die oben angegebenen Bedeutungen hat.

15 Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl oder Alkenyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein. Ebenfalls können doppelt gebundene Kohlenwasserstoffreste wie Alkylen (Alkandiyl) soweit möglich jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

20 Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein können. So schließt die Definition Dialkylamino auch eine unsymmetrisch durch Alkyl substituierte Aminogruppe wie z.B. Methyl-ethylamino ein.

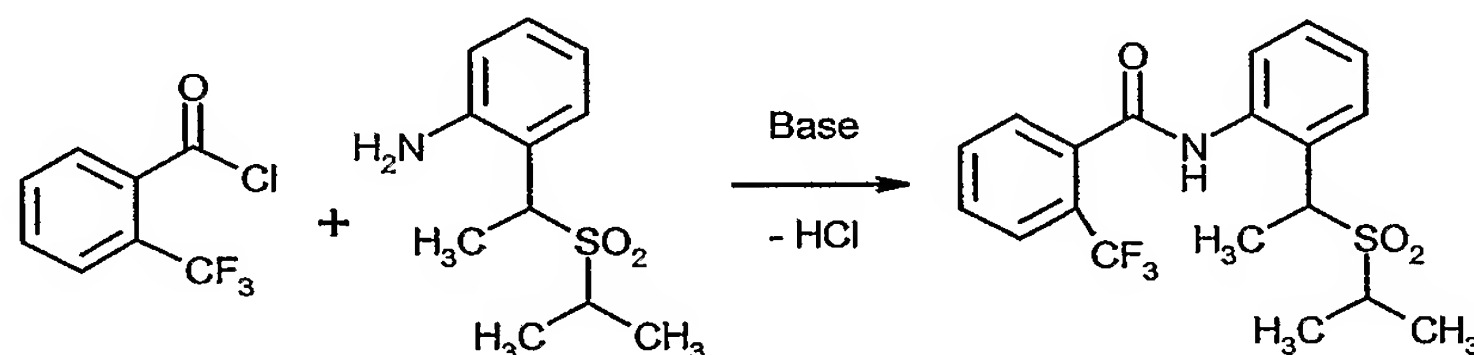
25 Durch Halogen substituierte Reste, wie z.B. Halogenalkyl, sind einfach oder mehrfach halogeniert. Bei mehrfacher Halogenierung können die Halogenatome gleich oder verschieden sein. Halogen steht dabei für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

30 Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen bzw. Erläuterungen können zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend. Insbesondere können die in den Gruppen 1 bis 6 genannten Verbindungen sowohl mit den allgemeinen wie auch mit bevorzugten, besonders bevorzugten usw. Bedeutungen kombiniert werden, wobei auch hier jeweils alle Kombinationen zwischen den Vorzugsbereichen möglich sind.

Beschreibung der erfindungsgemäßen Verfahren zum Herstellen der Hexylcarboxanilide der Formel (I) sowie der Zwischenprodukte

Verfahren (a)

- 5 Verwendet man 2-Trifluormethylbenzoesäurechlorid und {2-[1-(Isopropylsulfonyl)ethyl]phenyl}-amin als Ausgangsstoffe, so kann das erfindungsgemäße Verfahren (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



- 10 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Carbonsäure-Derivate sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) hat A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für A angegeben wurden. X¹ steht bevorzugt für Chlor, Brom oder Hydroxy.

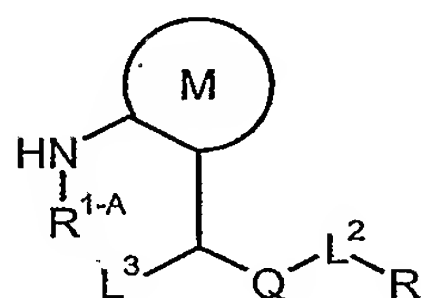
15

Die Carbonsäure-Derivate der Formel (II) sind größtenteils bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen (vgl. WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 und EP-A 0 589 313).

- 20 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Anilin-Derivate sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) haben R¹, M, Q, L² und R bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden. L³ steht bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₅-Alkyl, besonders bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl.
- 25

Die Anilin-Derivate der Formel (III) sind neu.

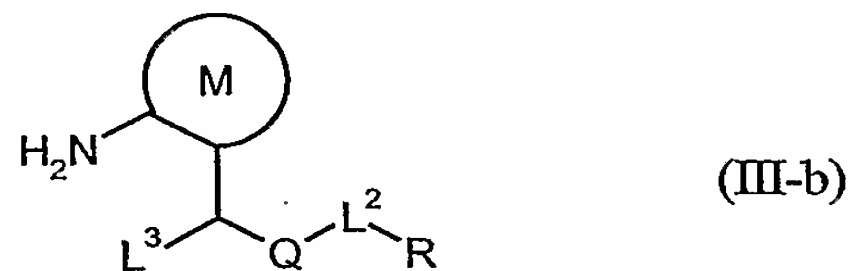
Anilin-Derivate der Formel (III-a)



(III-a)

in welcher R^{1-A} , M, Q, L^2 , R und L^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben, werden erhalten, indem man

(d) Anilin-Derivate der Formel (III-b)



5 in welcher M, Q, L^2 , R und L^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit Halogeniden der Formel (VI)

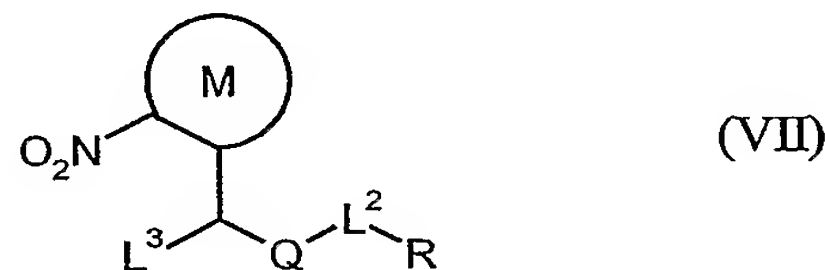


in welcher R^{1-A} und X^2 die oben angegebenen Bedeutungen haben, in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

10

Anilin-Derivate der Formel (III-b) werden erhalten, indem man

(e) eine Nitro-Verbindung der Formel (VII)



15

in welcher M, Q, L^2 , R und L^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben, in Gegenwart eines Metalls und eines Reduktionsmittels sowie gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Reaktionshilfsmittels umgesetzt.

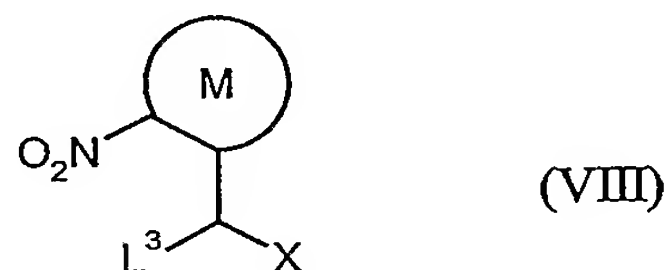
20

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) als Ausgangsstoffe benötigten Nitro-Verbindungen sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel (VII) haben M, Q, L^2 , R und L^3 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) bzw. der Formel (III) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

25

Nitro-Verbindungen der Formel (VII) werden erhalten, indem man

(f) eine Nitro-Verbindung der Formel (VIII)

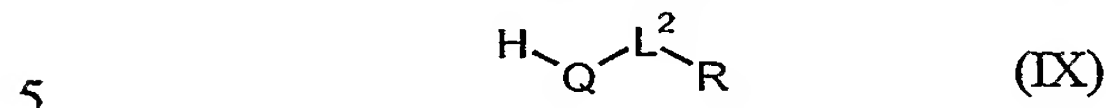


in welcher

M und L³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

X für Chlor, Brom oder Iod steht,

mit einer Verbindung der Formel (IX)



in welcher Q, L² und R die oben angegebenen Bedeutungen haben,

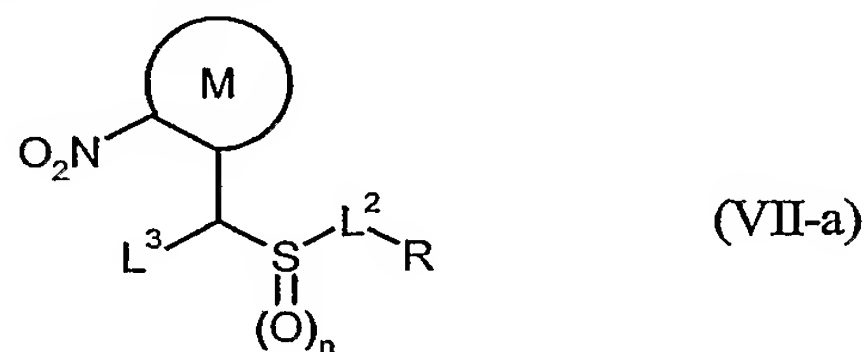
in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

- 10 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe benötigten Nitro-Verbindungen sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel (VIII) haben M und L³ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) bzw. der Formel (III) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese
- 15 Reste angegeben wurden. X steht bevorzugt für Chlor.

- Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen sind durch die Formel (IX) allgemein definiert. In dieser Formel (IX) haben Q, L² und R bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die
- 20 bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) bzw. der Formel (III) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

- Verbindungen der Formel (IX) sind bekannt oder können nach bekannten Verfahren erhalten werden.
- 25

Nitro-Verbindungen der Formel (VII-a)



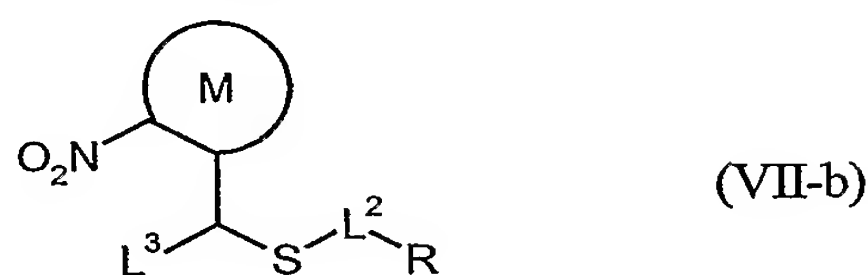
in welcher

M, L², R und L³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

- 30 n für 1 oder 2 steht,

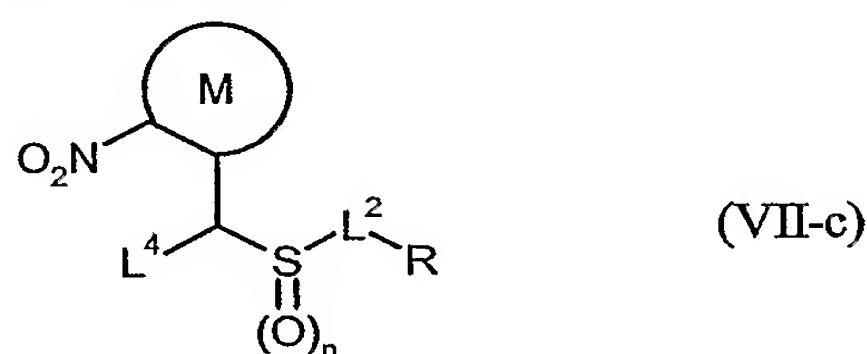
werden erhalten, indem man

(g) eine Nitro-Verbindung der Formel (VII-b)



in welcher M, L², R und L³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,
in Gegenwart eines Oxidationsmittels sowie gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdün-
5 nungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Reaktionshilfsmittels umgesetzt.

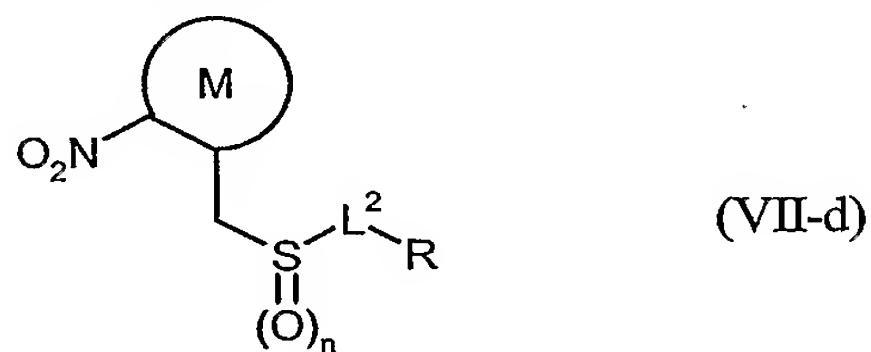
Nitro-Verbindungen der Formel (VII-c)



in welcher
10 M, L², R und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,
L⁴ für C₁-C₉-Alkyl, bevorzugt für C₁-C₅-Alkyl, besonders bevorzugt für Methyl steht,

werden erhalten, indem man

(h) eine Nitro-Verbindung der Formel (VII-d)



15

in welcher M, L², R und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,
mit Halogeniden der Formel (X)



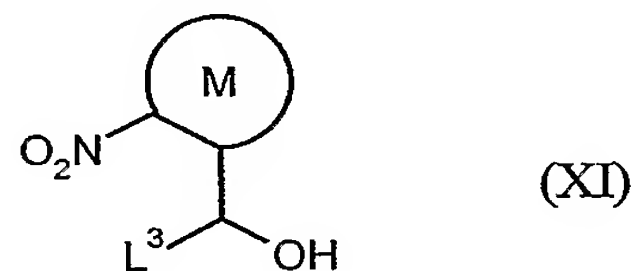
in welcher L⁴ und X² die oben angegebenen Bedeutungen haben,
20 in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt..

Halogenide der Formel (X) sind bekannt.

Die Verbindungen der Formeln (VII-a), (VII-b), (VII-c) und (VII-d) sind Untergruppen der Nitro-
25 Verbindungen der Formel (VII) und werden von der allgemeinen Beschreibung dieser Verbindungen
umfasst. Die bevorzugten, besonders bevorzugten usw. Definitionen gelten hier entsprechend.

Nitro-Verbindungen der Formel (VIII) werden erhalten, indem man

(j) Hydroxy-Derivate der Formel (XI)



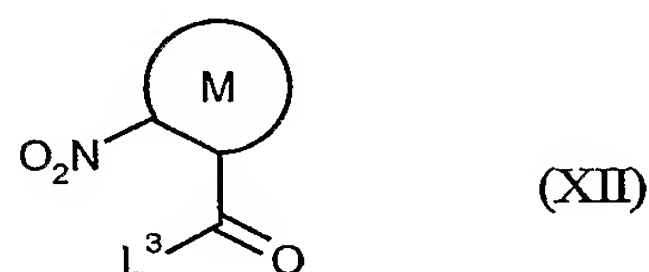
in welcher M und L³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators halogeniert.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) als Ausgangsstoffe benötigten Hydroxy-Derivate sind durch die Formel (XI) allgemein definiert. In dieser Formel (XI) haben M und
 10 L³ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) bzw. der Formel (III) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

15 Hydroxy-Derivate der Formel (XI) werden erhalten, indem man

(k) acylierte Aromaten der Formel (XII)



in welcher M und L³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

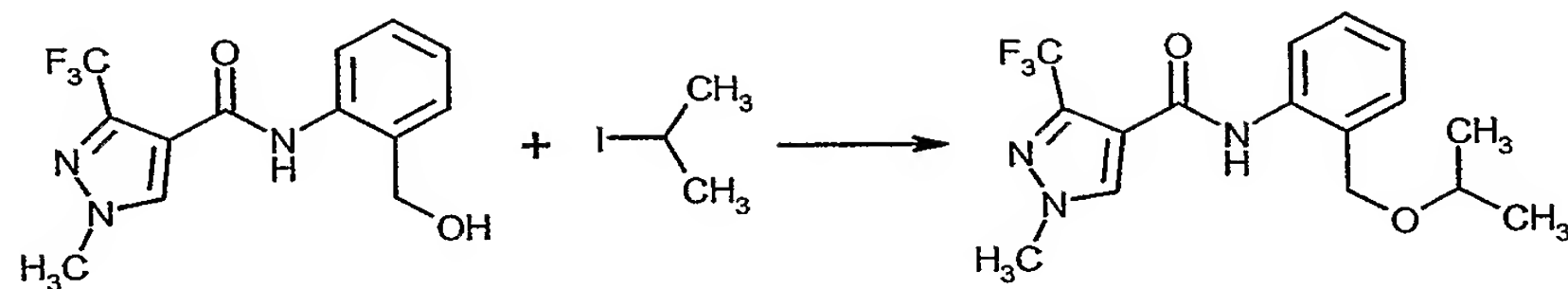
in Gegenwart eines Reduktionsmittels sowie gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdün-
 20 nungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators umgesetzt.

Anilin-Derivate der Formel (III) können auch in Analogie zu bekannten Verfahren erhalten werden (vgl. EP-A 0 737 682).

25

Verfahren (b)

Verwendet man N-[2-(Hydroxymethyl)phenyl]-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid und 2-Iodpropan als Ausgangsstoffe, so kann das erfindungsgemäße Verfahren (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



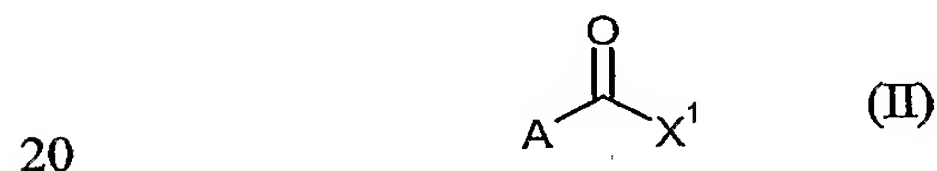
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Carboxamide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel (IV) haben M, L¹, Q und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als

bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für A angegeben wurden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel (V) haben L² und R bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für A angegeben wurden. Y steht bevorzugt für Chlor, Brom, Iod, Triflat (Trifluormethylsulfonyl), Mesylat (Methylsulfonyl) oder Tosylat (4-Methylphenylsulfonyl), besonders bevorzugt für Brom, Iod oder Triflat (Trifluormethylsulfonyl).

Verbindungen der Formel (V) sind bekannt oder können nach bekannten Verfahren erhalten werden. Carboxamide der Formel (IV) sind neu. Sie werden erhalten, indem man

(m) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)

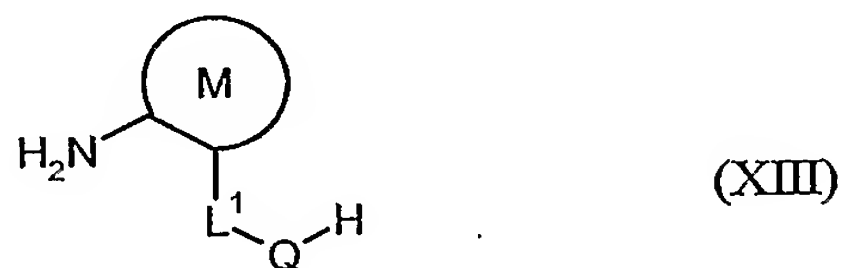


in welcher

A die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X¹ für Halogen oder Hydroxy steht,

mit Anilin-Derivaten der Formel (XIII)



in welcher M, L¹ und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

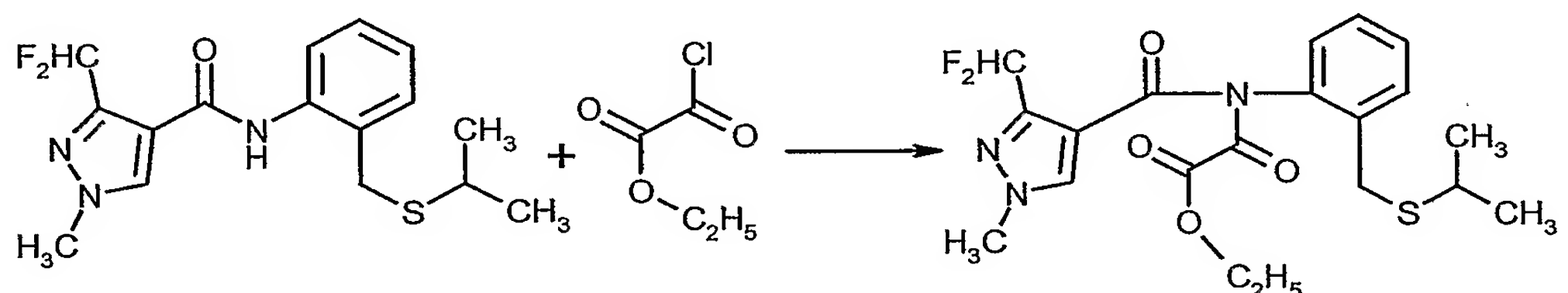
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (m) als Ausgangsstoffe benötigten Carbonsäure-Derivate der Formel (II) sind bereits in Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) beschrieben worden.

- 5 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (m) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Anilin-Derivate sind durch die Formel (XIII) allgemein definiert. In dieser Formel (XIII) haben M, L¹ und Q bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden.

Anilin-Derivate der Formel (XIII) sind bekannt oder können nach bekannten Verfahren erhalten werden.

15 Verfahren (c)

Verwendet man 3-(Difluormethyl)-N-{2-[(isopropylthio)methyl]phenyl}-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamid und Ethyl-chlor(oxo)acetat als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



- 20 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Hexylcarboxanilide sind durch die Formel (I-a) allgemein definiert. In dieser Formel (I-a) haben M, L¹, Q, L², R und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

Die Hexylcarboxanilide der Formel (I-a) sind ebenfalls erfindungsgemäße Verbindungen und Gegenstand dieser Anmeldung. Sie können nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) erhalten werden (mit R¹ = Wasserstoff).

30

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Halogenide sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel (VI) hat R^{1-A} bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammen-

hang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-b) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben wurden. X^2 steht bevorzugt für Chlor oder Brom.

5 Halogenide der Formel (VI) sind bekannt.

Reaktionsbedingungen

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (m) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyc-
10 lische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-
15 Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (m) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen
20 Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie z.B. Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat,
25 sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (m) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten
30 Kondensationsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Amidierungsreaktionen verwendbaren Kondensationsmittel infrage. Beispielhaft genannt seien Säurehalogenidbildner wie Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid, Oxalylchlorid oder Thionylchlorid; Anhydridbildner wie Chlorameisensäureethylester, Chlorameisensäuremethylester, Chlorameisensäureisopropylester, Chlorameisensäureisobutylester
35 oder Methansulfonylchlorid; Carbodiimide, wie N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder andere übliche Kondensationsmittel, wie Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbonyldiimidazol,

2-Ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin (EEDQ), Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff oder Brom-tripyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphat.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (m) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Beispielsweise genannt seien 4-Dimethylaminopyridin, 1-Hydroxy-benzotriazol oder Dimethylformamid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (m) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 80°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro mol des Carbonsäure-Derivates der Formel (II) im Allgemeinen 0,2 bis 5 mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 mol an Anilin-Derivat der Formel (III) ein.

15

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (m) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (IV) setzt man pro mol des Carbonsäure-Derivates der Formel (II) im Allgemeinen 0,2 bis 5 mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 mol an Anilin-Derivat der Formel (XIII) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (b), (c), (d) und (h) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlor-ethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (b), (c), (d) und (h) werden in Gegenwart einer Base durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie z.B. Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Caesiumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trime-

thylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

- 5 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (b), (c), (d) und (h) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 110°C.

10 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Carboxamids der Formel (IV) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an einer Verbindung der Formel (V) ein.

15 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Hexylcarboxanilids der Formel (I-a) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Halogenid der Formel (VI) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (III-a) setzt man pro Mol des Anilin-Derivates der Formel (III-b) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Halogenid der Formel (VI) ein.

20

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (VII-c) setzt man pro Mol einer Nitro-Verbindung der Formel (VII-d) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Halogenid der Formel (X) ein.

25 Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan
30 oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder iso-Propanol, n-, iso-, sec- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, Triethylenglykol, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

35

Das erfindungsgemäße Verfahren (e) wird in Gegenwart eines Metalls durchgeführt. Als solche kom-

men vorzugsweise Übergangsmetalle, wie beispielsweise Palladium, Platin, Rhodium, Nickel (Raney-Nickel), Eisen, Cobalt, Ruthenium, Iridium, Zink, oder Osmium infrage. Die Metalle können gegebenenfalls an Trägermaterialien, wie z. B. Kohle, Harze, Zeolithe, Alkali- oder Erdalkalisulfate gebunden sein.

5

Das erfindungsgemäße Verfahren (e) wird in Gegenwart eines Reduktionsmittels durchgeführt. Als solche kommen vorzugsweise elementarer Wasserstoff, Formiatsalze, vorzugsweise Alkaliformiatsalze, wie z. B. Natriumformiat, aber auch Ammoniumformiat oder auch Metallhydride bzw. komplexe Metallhydride, wie z.B. Lithiumaluminiumhydrid, Natriumborhydrid infrage.

10

Das erfindungsgemäße Verfahren (e) kann in Gegenwart von Säuren durchgeführt werden. Als solche kommen vorzugsweise organische Säuren, wie z. B. Ameisensäure, Essigsäure, Ascorbinsäure, aber auch Mineralsäuren, wie z.B. Salzsäure oder Schwefelsäure infrage.

15 Das erfindungsgemäße Verfahren (e) kann in Gegenwart von Basen durchgeführt werden. Als solche kommen vorzugsweise organische Basen, wie z. B. Pyridin, aber auch wässrige Lösungen von Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxiden, wie z.B. Natriumhydroxid oder Bariumhydroxid infrage.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) in
20 einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von -80°C bis 300°C , vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 200°C .

Bei der Verwendung von elementarem Wasserstoff wird das erfindungsgemäße Verfahren (e) unter einem Wasserstoffdruck zwischen 0,5 und 200 bar, bevorzugt zwischen 1 und 100 bar durchgeführt.

25

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (III-b) setzt man pro Mol einer Nitro-Verbindung der Formel (VII) im Allgemeinen 0,8 bis 1000 Mol, vorzugsweise 1 bis 500 Mol an Reduktionsmittel (Ammoniumformiat, Hydrid etc.) ein.

30 Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan;
35 Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-Dime-

thylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

- Das erfindungsgemäße Verfahren (f) wird in Gegenwart einer Base durchgeführt. Als solche kommen
- 5 alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie z.B. Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Na-
- 10 triumhydrogencarbonat oder Caesiumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).
- 15 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahren (f) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 200°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 150°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) zur Herstellung der Verbindungen der

20 Formel (VII) setzt man pro Mol einer Nitro-Verbindung der Formel (VIII) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol einer Verbindung der Formel (IX) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische

25 oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Sulfoxide, wie Dimethyl-

30 sulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.

Das erfindungsgemäße Verfahren (g) wird in Gegenwart eines Oxidationsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle organischen und anorganischen Oxidationsmittel infrage, vorzugsweise elementarer Sauerstoff, Ozon, Peroxide, wie z.B. Wasserstoffperoxid, m-Chlorperbenzoesäure, Benzoyl-

35 peroxid, tert.-Butylperoxid; Chlorlauge (Natriumhypochlorid); Chromsalze wie z.B. Chrom(VI)-oxid,

Chromsäure, Natriumdichromat, Pyridiniumchlorochromat; Mangansalze, wie z.B. Kaliumpermanganat, Braunstein; Selendioxid; Iodate und Periodate; Kaliumperoxodisulfat.

Das erfindungsgemäße Verfahren (g) kann in Gegenwart von Säuren durchgeführt werden. Als solche kommen vorzugsweise organische Säuren, wie z. B. Ameisensäure, Essigsäure, Ascorbinsäure, aber auch Mineralsäuren, wie z.B. Salzsäure oder Schwefelsäure infrage.

Das erfindungsgemäße Verfahren (g) kann in Gegenwart von Basen durchgeführt werden. Als solche kommen vorzugsweise organische Basen, wie z. B. Pyridin, aber auch wässrige Lösungen von Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxiden, wie z.B. Natriumhydroxid oder Bariumhydroxid infrage.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von -80°C bis 300°C , vorzugsweise bei Temperaturen von -20°C bis 100°C .

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (VII-a) setzt man pro Mol einer Nitro-Verbindung der Formel (VII-b) im Allgemeinen 0,6 bis 10 Mol, vorzugsweise 0,8 bis 5 Mol an Oxidationsmittel ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

Das erfindungsgemäße Verfahren (j) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie z.B. Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, so-

wie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

- 5 Das erfindungsgemäße Verfahren (j) wird in Gegenwart eines geeigneten Halogenierungsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Halogenierungsreaktionen verwendbaren Halogenierungsmittel infrage. Beispielhaft genannt seien Halogenidbildner wie Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid, Oxalylchlorid oder Thionylchlorid; Anhydridbildner wie Chlorameisensäureethylester, Chlorameisensäuremethylester, Chlorameisensäureisopropylester, Chlorameisensäureisobutylester oder Methansulfonylchlorid; 10 oder andere übliche Kondensationsmittel, wie Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbonyldiimidazol, 2-Ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin (EEDQ), Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff oder Brom-tripyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphat.
- 15 Das erfindungsgemäße Verfahren (j) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Beispielsweise genannt seien 4-Dimethylaminopyridin, 1-Hydroxy-benzotriazol oder Dimethylformamid.

- Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) in 20 einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 200°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 150°C.

- Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (VIII) setzt man pro mol eines Hydroxy-Derivates der Formel (XI) im Allgemeinen 0,2 bis 10 25 mol, vorzugsweise 0,5 bis 5 mol an Halogenierungsmittel ein.

- Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, iso-Propanol. 35

Das erfindungsgemäße Verfahren (k) wird in Gegenwart eines geeigneten Reduktionsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Reduktionsmittel infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, wie z.B. Natriumhydrid, oder komplexe Hydride, wie z.B. Lithiumaluminiumhydrid, Natriumborhydrid, Natriumcyanoborhydrid, Diisobutylaluminiumhydrid, Boran, Diboran oder Borankomplexe, wie z.B. Boran-Pyridin, Silane, wie z.B. Triethylsilan, Metalle, wie z.B. Natrium, Lithium, Zink, Eisen, oder Wasserstoff.

Das erfindungsgemäße Verfahren (k) wird gegebenenfalls in Gegenwart einer geeigneten Säure oder Lewissäure durchgeführt. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Säure/Lewissäure vermittelten Reduktionen verwendbaren Säuren/Lewissäuren infrage. Beispielhaft genannt seien Salzsäure, Essigsäure, Trifluoressigsäure, Bortrifluorid oder komplexe Bortrifluoride, wie z.B. Bortrifluoridetherat, Aluminiumtrichlorid, Certrichlorid, anorganische oder organische Titanverbindungen, wie z.B. Titanetetrachlorid, Titanettraisopropylat.

Das erfindungsgemäße Verfahren (k) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Beispielsweise genannt seien Metalle oder Metallsalze, insbesondere Übergangsmetalle oder deren Salze, wie z.B. Platin, Palladium, Nickel (Raney-Nickel), Iridium, Rhodium, Osmium, Eisen, Ruthenium, Cobalt. Diese Metalle bzw. Metallsalze können gegebenenfalls auch an Harze oder Oberflächen bzw. Trägermaterialien (z. B. Kohle) gebunden oder aufgetragen sein.

20

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 200°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 150°C.

Bei der Verwendung von Wasserstoff als Reduktionsmittel kann das erfindungsgemäße Verfahren (k) in einem größeren Druckbereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Drücken von 1 bar bis 300 bar, vorzugsweise bei 1 bar bis 100 bar.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (XI) setzt man pro mol eines acylierten Aromaten der Formel (XII) im Allgemeinen 0,2 bis 10 mol, vorzugsweise 0,5 bis 5 mol an Reduktionsmittel ein.

Wenn nicht anders angegeben, werden alle erfindungsgemäßen Verfahren im Allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck – im Allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar – zu arbeiten.

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

- 5 Fungizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

10

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

- 15 Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora;

Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;

Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise Pseudoperonospora humuli oder Pseudoperonospora cubensis;

- 20 Plasmopara-Arten, wie beispielsweise Plasmopara viticola;

Bremia-Arten, wie beispielsweise Bremia lactucae;

Peronospora-Arten, wie beispielsweise Peronospora pisi oder P. brassicae;

Erysiphe-Arten, wie beispielsweise Erysiphe graminis;

Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise Sphaerotheca fuliginea;

- 25 Podosphaera-Arten, wie beispielsweise Podosphaera leucotricha;

Venturia-Arten, wie beispielsweise Venturia inaequalis;

Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise Pyrenophora teres oder P. graminea

(Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise Cochliobolus sativus

- 30 (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;

Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;

Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise Sclerotinia sclerotiorum;

Tilletia-Arten, wie beispielsweise Tilletia caries;

- 35 Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;

Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;

Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;

Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;

Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;

Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;

5 Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;

Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;

Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;

Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercospora herpotrichoides*,

Rhizoctonia-Arten, wie beispielsweise *Rhizoctonia solani*.

10

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine starke stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

15 Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

20 Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit
25 den Wirkstoffen.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

30

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen *Puccinia*-Arten und von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen *Botrytis*-, *Venturia*- oder *Alternaria*-Arten, einsetzen.

35

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind

außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur
5 Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wild-
10 pflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sorten-
15 schutzrechte schützbaeren oder nicht schützbaeren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

20

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges
25 Umhüllen.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

30 Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikro-
35 organismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Ver-

mehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

5

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und

10

Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

Alternaria, wie *Alternaria tenuis*,

Aspergillus, wie *Aspergillus niger*,

15

Chaetomium, wie *Chaetomium globosum*,

Coniophora, wie *Coniophora puetana*,

Lentinus, wie *Lentinus tigrinus*,

Penicillium, wie *Penicillium glaucum*,

Polyporus, wie *Polyporus versicolor*,

20

Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,

Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,

Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,

Escherichia, wie *Escherichia coli*,

Pseudomonas, wie *Pseudomonas aeruginosa*,

25

Staphylococcus, wie *Staphylococcus aureus*.

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/ oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren

30

Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/ oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also

35

Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungs-

mittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im Wesentlichen infrage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfractionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen infrage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen infrage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Bims, Marmor, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstängel. Als Emulgier und/oder schaum erzeugende Mittel kommen infrage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylaryl-polyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen infrage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

20

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kepheline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

25

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

30

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

35

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der

Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen infrage:

Fungizide:

- 5 2-Phenylphenol; 8-Hydroxychinolinsulfat; Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potassium; Andoprim; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin; Benalaxyl; Benalaxyl-M; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamacril; Benzamacril-isobutyl; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamin; Calcium polysulfide; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone;
- 10 vone; Chinomethionat; Chlobenthiazole; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenconazole; Diflumentorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon; Edifenphos;
- 15 Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil; Furmecyclox; Guazatine; Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris(albesiate)l; Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione; Kasugamycin; Kresoxim-methyl; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomycin; Myclobutanil; Myclobutyl; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl;
- 25 Noviflumuron; Nuarimol; Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxpoconazole; Oxy-carboxin; Oxyfenthiin; Paclobutrazol; Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propanosine-sodium; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifenox; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine; Quinconazole; Quinoxifen; Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-methyl; Tolyfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutyl; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole; Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-Chlorphenyl)-2-propinyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamid; 1-(1-Naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion;
- 35 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin; 2-Amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolcarboxamid; 2-

Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamide; 3,4,5-Trichlor-2,6-pyridin-dicarbonitril; Actinovate; cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol; Methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat; Monokaliumcarbonat; N-(6-Methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid; N-Butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amin; Na-
 5 triumtetrathiocarbonat; sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie Bordeaux mixture; Kupferhydroxid; Kupfernaphthenat; Kupferoxychlorid; Kupfersulfat; Cufraneb; Kupferoxid; Mancopper; Oxine-copper.

Bakterizide:

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Oethilinin,
 10 Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

1. Acetylcholinesterase (AChE) Inhibitoren

15 1.1 Carbamate (z.B. Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allyxycarb, Aminocarb, Azamethiphos, Bendiocarb, Benfuracarb, Bufencarb, Butacarb, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Carbaryl, Carbofuran, Carbosulfan, Chloethocarb, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Dimetilan, Ethiofencarb, Fenobucarb, Fenothiocarb, Formetanate, Furathiocarb, Isoprocab, Metam-sodium, Methiocarb, Methomyl, Metolcarb, Oxamyl, Pirimicarb, Promecarb, Propoxur, Thiodicarb,
 20 Thiofanox, Triazamate, Trimethacarb, XMC, Xylcarb)
 1.2 Organophosphate (z.B. Acephate, Azamethiphos, Azinphos (-methyl, -ethyl), Bromophos-ethyl, Bromfenvinfos (-methyl), Butathiofos, Cadusafos, Carbophenothion, Chlorethoxyfos, Chlorfenvinphos, Chlormephos, Chlorpyrifos (-methyl/-ethyl), Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Chlorfenvinphos, Demeton-S-methyl, Demeton-S-methylsulphon, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion,
 25 Dichlorvos/DDVP, Dicrotophos, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dioxabenzofos, Disulfoton, EPN, Ethion, Ethoprophos, Etrimfos, Famphur, Fenamiphos, Fenitrothion, Fensulfothion, Fenthion, Flupyrazofos, Fonofos, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Heptenophos, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isopropyl O-salicylate, Isoxathion, Malathion, Mecarbam, Methacrifos, Methamidophos, Methidathion, Mevinphos, Monocrotophos, Naled, Omethoate, Oxydemeton-methyl, Para-
 30 thion (-methyl/-ethyl), Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Pirimiphos (-methyl/-ethyl), Profenofos, Propaphos, Propetamphos, Prothiofos, Prothoate, Pyraclofos, Pyridaphenthion, Pyridathion, Quinalphos, Sebufos, Sulfotep, Sulprofos, Tebupirimfos, Temephos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Thiometon, Triazophos, Triclorfon, Vamidothion)

2. Natrium-Kanal-Modulatoren / Spannungsabhängige Natrium-Kanal-Blocker

35 2.1 Pyrethroide (z.B. Acrinathrin, Allethrin (d-cis-trans, d-trans), Beta-Cyfluthrin, Bifenthrin, Bioallethrin, Bioallethrin-S-cyclopentyl-isomer, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Chlo-

- vaporthrin, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clocythrin, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cypermethrin (alpha-, beta-, theta-, zeta-), Cyphenothrin, DDT, Deltamethrin, Ementhrin (1R-isomer), Esfenvalerate, Etofenprox, Fenfluthrin, Fenpropathrin, Fenpyrithrin, Fenvalerate, Flubrocycrin, Flucythrinate, Flufenprox, Flumethrin, Fluvalinate, Fubfenprox, Gamma-
- 5 Cyhalothrin, Imiprothrin, Kadethrin, Lambda-Cyhalothrin, Metofluthrin, Permethrin (cis-, trans-), Phenothrin (1R-trans isomer), Prallethrin, Profluthrin, Protrifenbute, Pyresmethrin, Resmethrin, RU 15525, Silafluofen, Tau-Fluvalinate, Tefluthrin, Terallethrin, Tetramethrin (1R-isomer), Tralome-thrin, Transfluthrin, ZXI 8901, Pyrethrins (pyrethrum))
- 2.2 Oxadiazine (z.B. Indoxacarb)
- 10 3. *Acetylcholin-Rezeptor-Agonisten/-Antagonisten*
- 3.1 Chloronicotinylen/Neonicotinoide (z.B. Acetamiprid, Clothianidin, Dinotefuran, Imidacloprid, Nitenpyram, Nithiazine, Thiacloprid, Thiamethoxam)
- 3.2 Nicotine, Bensultap, Cartap
4. *Acetylcholin-Rezeptor-Modulatoren*
- 15 4.1 Spinosyne (z.B. Spinosad)
5. *GABA-gesteuerte Chlorid-Kanal-Antagonisten*
- 5.1 Cyclodiene Organochlorine (z.B. Camphechlor, Chlordane, Endosulfan, Gamma-HCH, HCH, Heptachlor, Lindane, Methoxychlor)
- 5.2 Fiprole (z.B. Acetoprole, Ethiprole, Fipronil, Vaniliprole)
- 20 6. *Chlorid-Kanal-Aktivatoren*
- 6.1 Mectine (z.B. Abamectin, Avermectin, Enamectin, Enamectin-benzoate, Ivermectin, Milbemectin, Milbemycin)
7. *Juvenilhormon-Mimetika*
- (z.B. Diofenolan, Epofenonane, Fenoxycarb, Hydroprene, Kinoprene, Methoprene, Pyriproxifen,
- 25 Triprene)
8. *Ecdysonagonisten/disruptoren*
- 8.1 Diacylhydrazine (z.B. Chromafenozide, Halofenozide, Methoxyfenozide, Tebufenozide)
9. *Inhibitoren der Chitinbiosynthese*
- 9.1 Benzoylharnstoffe (z.B. Bistrifluron, Chlofluazuron, Diflubenzuron, Fluazuron, Flucycloxuron,
- 30 Flufenoxuron, Hexaflumuron, Lufenuron, Novaluron, Noviflumuron, Penfluron, Teflubenzuron, Tri-flumuron)
- 9.2 Buprofezin
- 9.3 Cyromazine
10. *Inhibitoren der oxidativen Phosphorylierung, ATP-Disruptoren*
- 35 10.1 Diafenthiuron
- 10.2 Organotine (z.B. Azocyclotin, Cyhexatin, Fenbutatin-oxide)

- 11. Entkoppler der oxidativen Phosphorylierung durch Unterbrechung des H-Protongradienten*
- 11.1 Pyrrole (z.B. Chlorfenapyr)
- 11.2 Dinitrophenole (z.B. Binapacryl, Dinobuton, Dinocap, DNOC)
- 12. Seite-I-Elektronentransportinhibitoren*
- 5 12.1 METI's (z.B. Fenazaquin, Fenpyroximate, Pyrimidifen, Pyridaben, Tebufenpyrad, Tolfenpyrad)
- 12.2 Hydramethylnone
- 12.3 Dicofol
- 13. Seite-II-Elektronentransportinhibitoren*
- 13.1 Rotenone
- 10 *14. Seite-III-Elektronentransportinhibitoren*
- 14.1 Acequinocyl, Fluacrypyrim
- 15. Mikrobielle Disruptoren der Insektendarmmembran*
- Bacillus thuringiensis-Stämme
- 16. Inhibitoren der Fettsynthese*
- 15 16.1 Tetronsäuren (z.B. Spirodiclofen, Spiromesifen)
- 16.2 Tetramsäuren [z.B. 3-(2,5-Dimethylphenyl)-8-methoxy-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl ethyl carbonate (alias: Carbonic acid, 3-(2,5-dimethylphenyl)-8-methoxy-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl ethyl ester, CAS-Reg.-No.: 382608-10-8) and Carbonic acid, cis-3-(2,5-dimethylphenyl)-8-methoxy-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl ethyl ester (CAS-Reg.-No.: 203313-25-1)]
- 20 *17. Carboxamide*
- (z.B. Flonicamid)
- 18. Oktopaminerge Agonisten*
- (z.B. Amitraz)
- 19. Inhibitoren der Magnesium-stimulierten ATPase*
- 25 (z.B. Propargite)
- 20. Phthalamide*
- (z.B. N²-[1,1-Dimethyl-2-(methylsulfonyl)ethyl]-3-iod-N¹-[2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluor-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl]-1,2-benzenedicarboxamide (CAS-Reg.-No.: 272451-65-7), Flubendiamide)
- 21. Nereistoxin-Analoge*
- 30 (z.B. Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiosultap-sodium)
- 22. Biologika, Hormone oder Pheromone*
- (z.B. Azadirachtin, Bacillus spec., Beauveria spec., Codlemone, Metarrhizium spec., Paecilomyces spec., Thuringiensin, Verticillium spec.)
- 23. Wirkstoffe mit unbekannten oder nicht spezifischen Wirkmechanismen*
- 35 23.1 Begasungsmittel (z.B. Aluminium phosphide, Methyl bromide, Sulfuryl fluoride)
- 23.2 Selektive Fraßhemmer (z.B. Cryolite, Flonicamid, Pymetrozine)

23.3 Milbenwachstumsinhibitoren (z.B. Clofentezine, Etoxazole, Hexythiazox)

23.4 Amidoflumet, Benclothiaz, Benzoximate, Bifenazate, Bromopropylate, Buprofezin, Chinomethi-
onat, Chlordimeform, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Clothiazoben, Cycloprene, Cyflumetofen, Di-
cycylanil, Fenoxacrim, Fentrifanil, Flubenzimine, Flufenerim, Flutenzin, Gossyplure, Hydramethyl-
5 none, Japonilure, Metoxadiazon, Petroleum, Piperonyl butoxide, Potassium oleate, Pyrafluprole,
Pyridalyl, Pyriprole, Sulfluramid, Tetradifon, Tetrasul, Triarathene, Verbutin,

ferner die Verbindung 3-Methyl-phenyl-propylcarbamate (Tsumacide Z), die Verbindung 3-(5-Chlor-3-
pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluorethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3)
10 und das entsprechende 3-endo-Isomere (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (vgl. WO 96/37494, WO
98/25923), sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren
enthalten.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und
15 Wachstumsregulatoren, Safener bzw. Semiochemicals ist möglich.

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimy-
kotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbeson-
dere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-
Spezies wie *Candida albicans*, *Candida glabrata*) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-
20 Spezies wie *Aspergillus niger* und *Aspergillus fumigatus*, Trichophyton-Spezies wie *Trichophyton*
mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie *Microsporon canis* und *audouinii*. Die Aufzählung dieser
Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat
nur erläuternden Charakter.

25 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwen-
dungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver,
Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B.
durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es
ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die
30 Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut
der Pflanzen behandelt werden.

Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach
Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflan-
35 zenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha,
vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an

Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

- 5 Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff „Teile“ bzw. „Teile von Pflanzen“ oder „Pflanzenteile“ wurde oben erläutert.

- 15 Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften („Traits“), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

- 20 Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive („synergistische“) Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

30

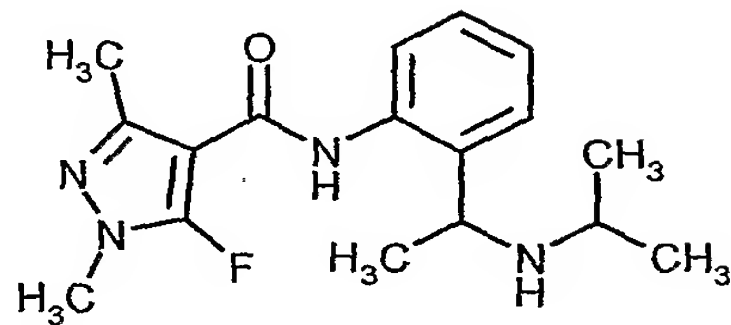
- Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften („Traits“) verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleuni-
- 35

gung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits“) werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten, Spinnentiere, Nematoden und Schnecken durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im Folgenden „Bt Pflanzen“). Als Eigenschaften („Traits“) werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften („Traits“) werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, z.B. Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits“) verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für „Bt Pflanzen“ seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits“).

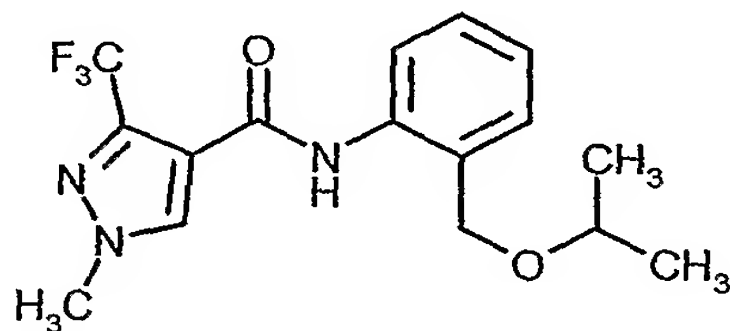
Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die

Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den folgenden
5 Beispielen hervor.

HerstellungsbeispieleHerstellung von Verbindung Nr. 40

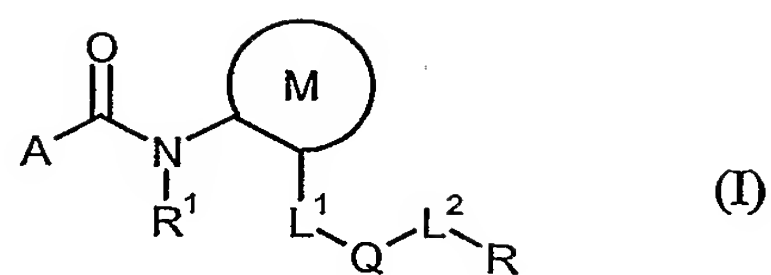
- 5 Zu einer Lösung bestehend aus 0,27 g (1,5 mmol) 2-[1-(Isopropylamino)ethyl]anilin (III-4) und 0,42 ml (3,0 mmol) Triethylamin in 5 ml Dichlormethan wird eine Lösung bestehend aus 0,27 g (1,5 mmol) 5-Fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carbonsäurechlorid in 10 ml Dichlormethan zuge-
- 10 tropft. Die Reaktionsmischung wird 2 Stunden bei 50°C und anschließend 16 h bei Raumtemperatur gerührt. Zur Aufarbeitung wird die Reaktionsmischung auf Wasser gegeben, die organische Phase über Magnesiumsulfat getrocknet und im Vakuum aufkonzentriert. Säulenchromatographie (Hexan/Aceton 4 : 1) liefert 0,27 g (56 % der Theorie) 5-Fluor-N-{2-[1-(isopropylamino)ethyl]phenyl}-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carboxamid [log P (pH 2,3) = 0,58].

Herstellung von Verbindung Nr. 60

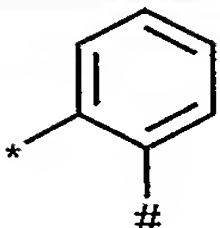
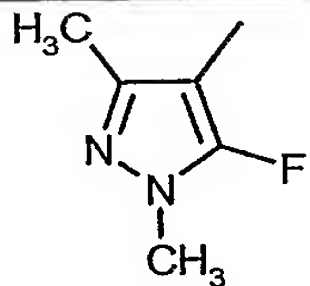
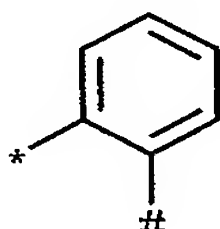
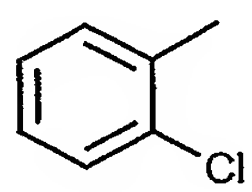
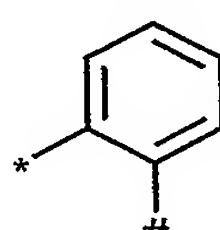
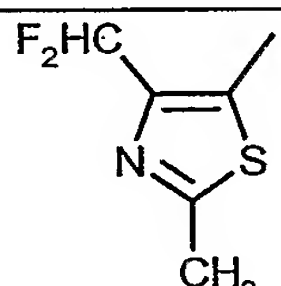
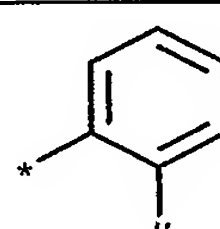
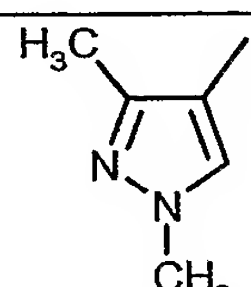
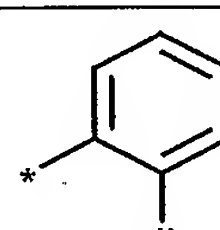
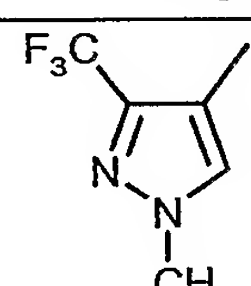
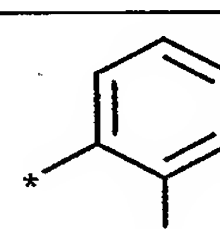
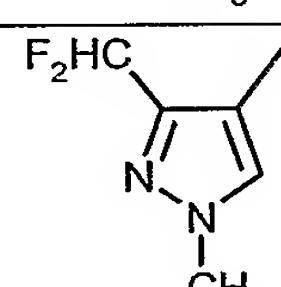
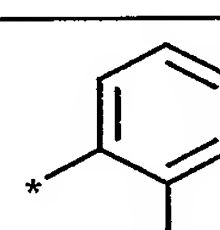
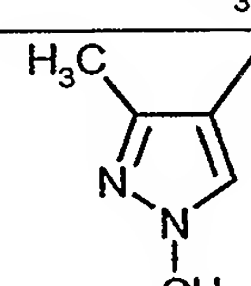
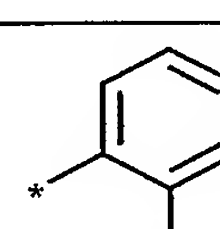
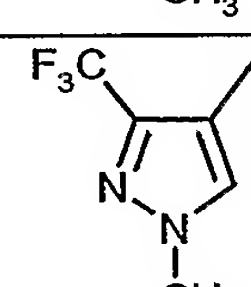
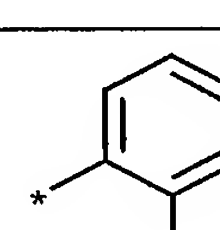
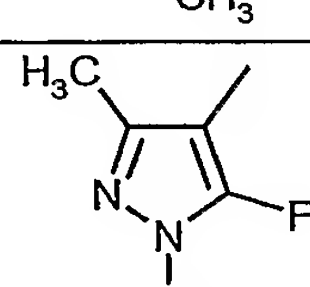
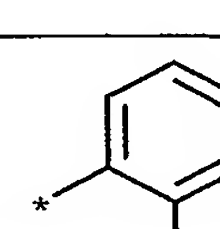
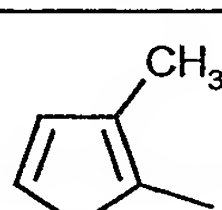
- 15 Bei Raumtemperatur werden 156,0 mg (3,9 mmol) 60%iges Natriumhydrid in Öl zu einer Lösung bestehend aus 897,8 mg (3,0 mmol) N-[2-(Hydroxymethyl)phenyl]-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid (IV-1) in 2 ml Dimethylformamid gegeben. Nach 30 Minuten werden 0,6 ml (6,0 mmol) 2-Iodpropan zugegeben. Die Reaktionsmischung wird 6 Stunden bei 100°C und 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird mit 1 ml Methanol versetzt, auf Wasser gegeben, mit Essigsäureethylester extrahiert, die organische Phase über Magnesiumsulfat getrocknet, vom
- 20 Trockenmittel abfiltriert und im Vakuum aufkonzentriert. Säulenchromatographie (Cyclohexan/Essigsäureethylester 3 : 1) liefert 100,0 mg (9,7 % der Theorie) an N-[2-(Isopropoxymethyl)phenyl]-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid [logP (pH 2,3) = 2,85].

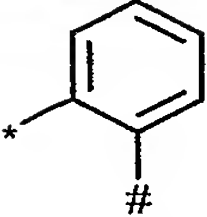
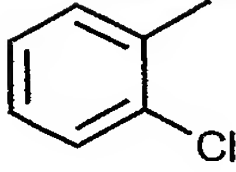
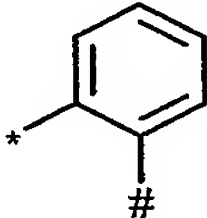
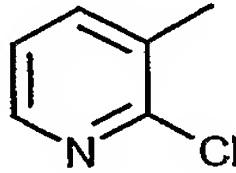
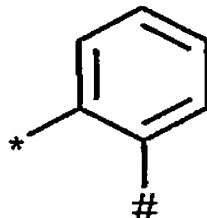
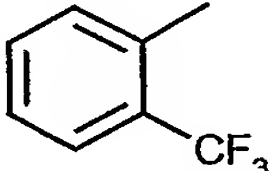
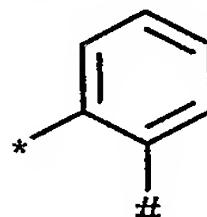
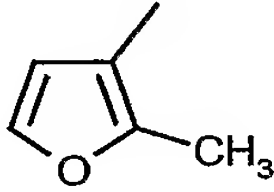
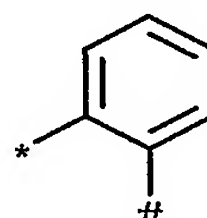
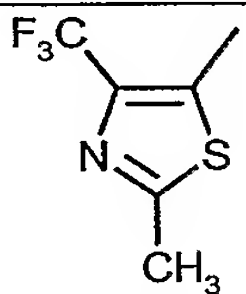
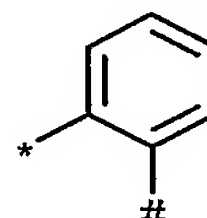
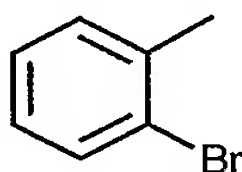
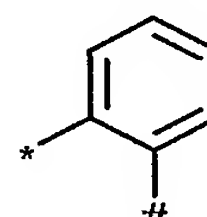
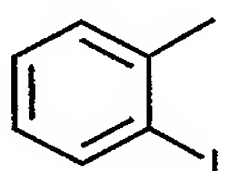
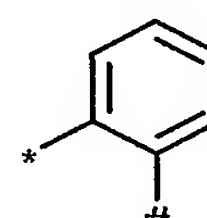
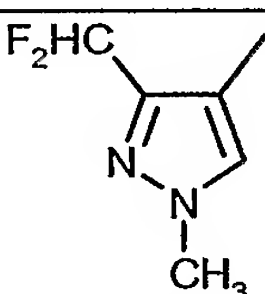
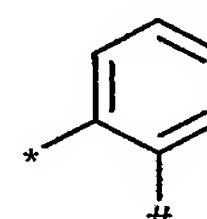
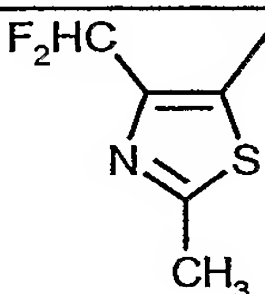
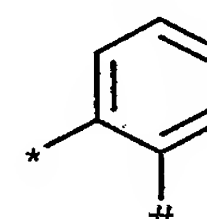
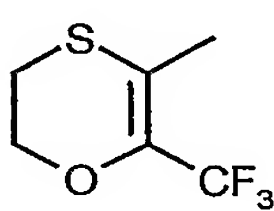
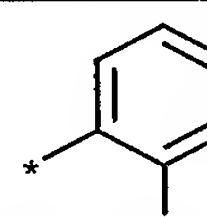
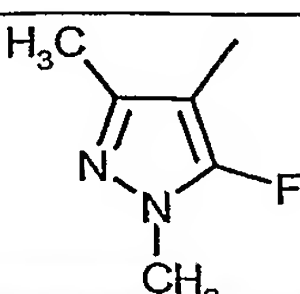
25

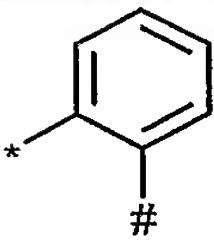
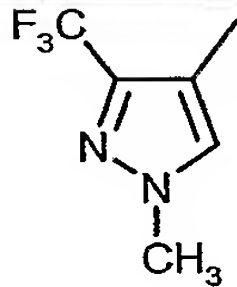
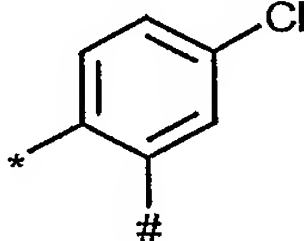
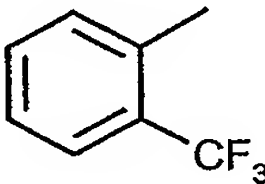
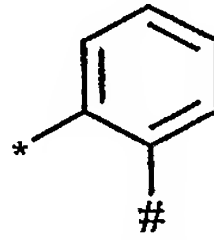
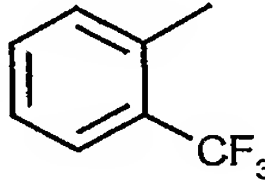
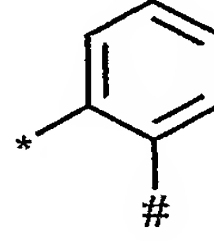
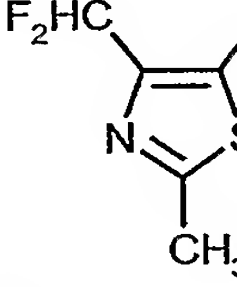
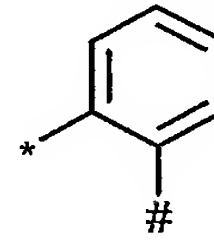
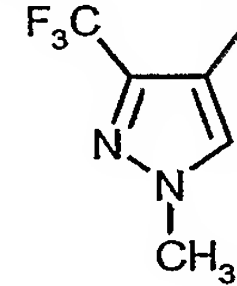
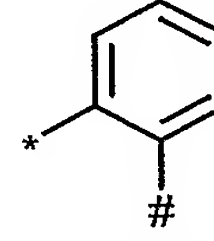
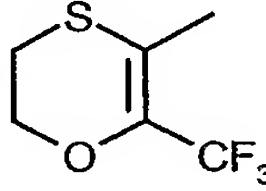
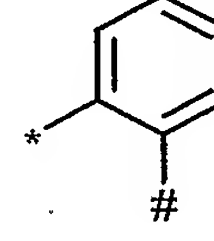
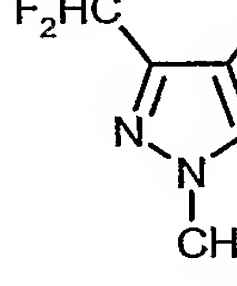
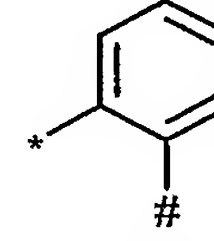
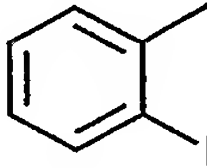
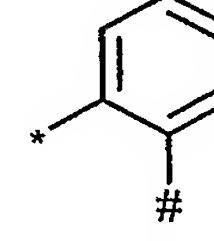
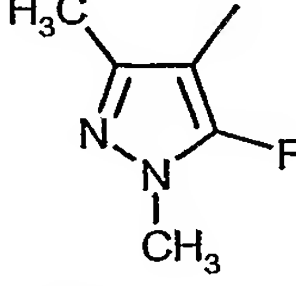
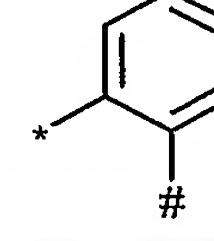
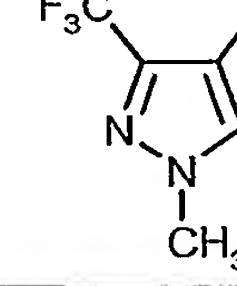
Analog Beispiel 1 und 2, sowie entsprechend den Angaben in der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellverfahren (a) bis (m) wurden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 genannten Verbindungen der Formel (I) erhalten:

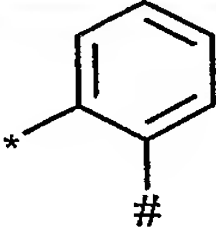
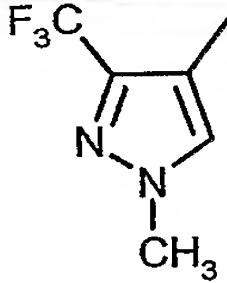
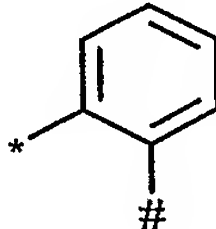
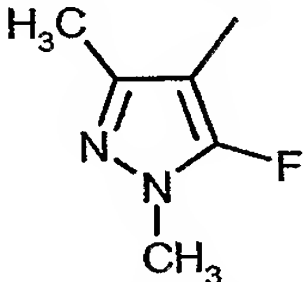
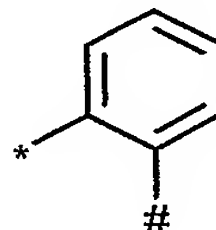
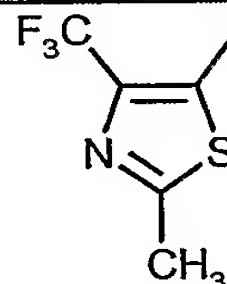
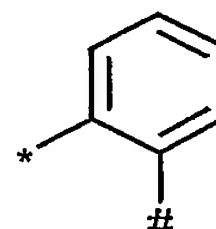
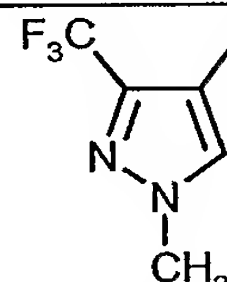
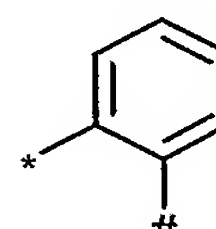
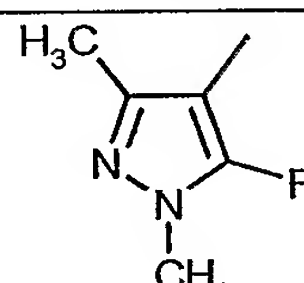
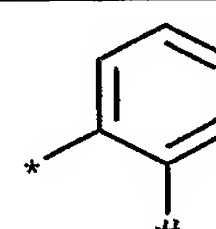
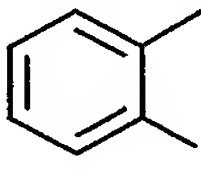
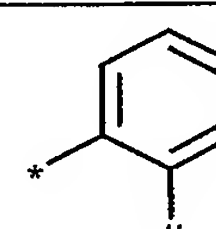
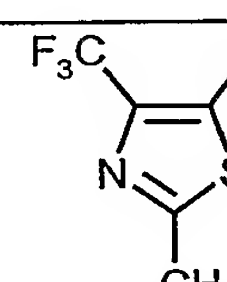
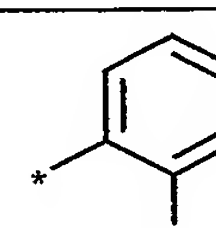
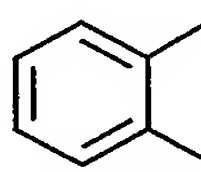
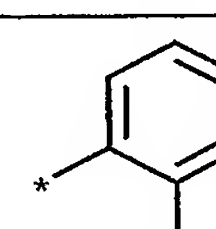
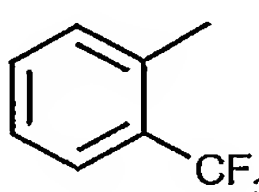
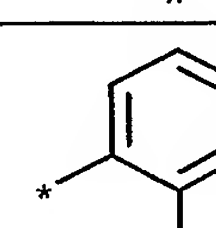
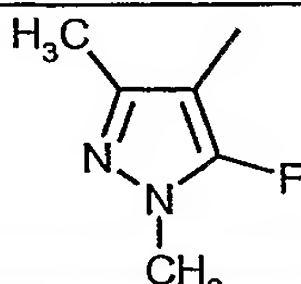
Tabelle 1

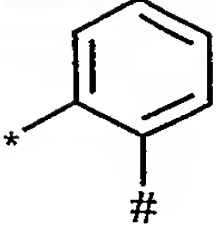
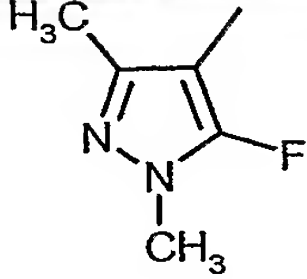
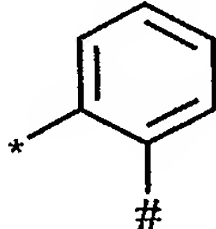
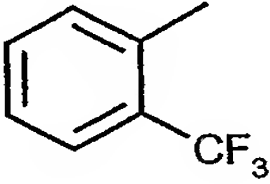
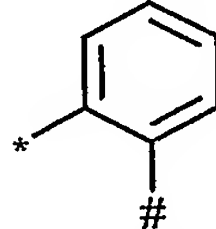
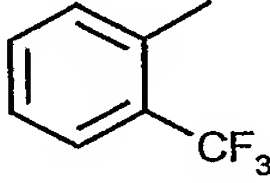
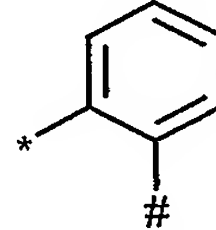
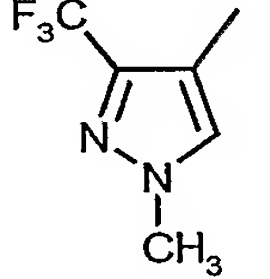
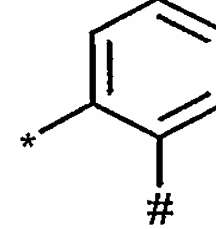
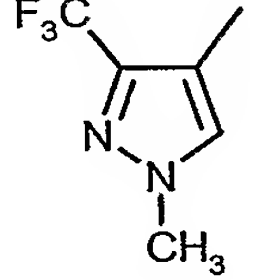
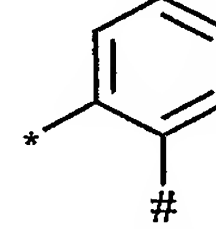
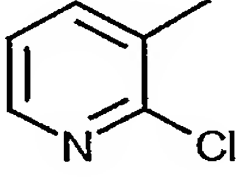
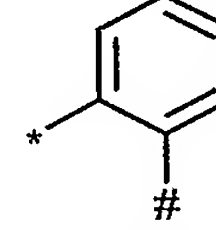
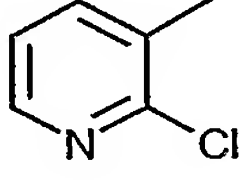
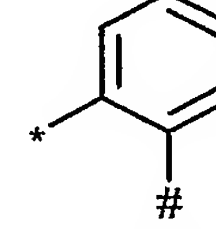
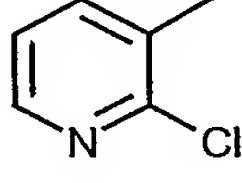
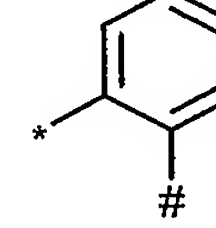
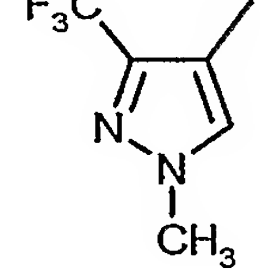
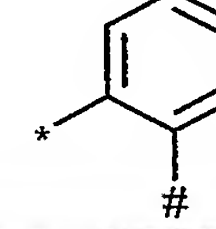
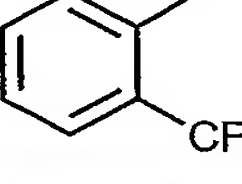
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
1	H		-CH ₂ -O-CH ₃		2,18
2	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		2,07
3	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		2,30
4	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		2,38
5	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		1,68
6	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		2,53
7	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		2,43
8	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		2,21
9	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		2,35
10	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		2,39

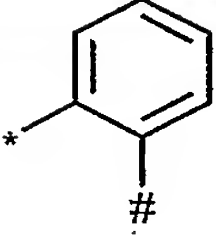
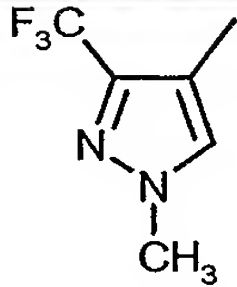
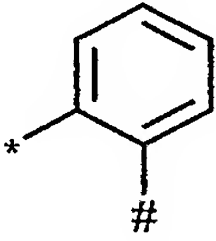
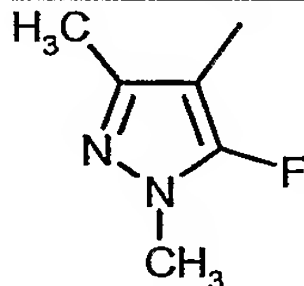
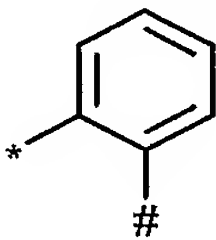
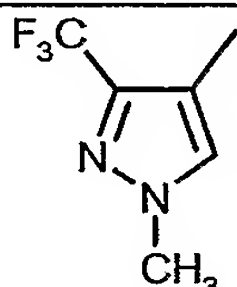
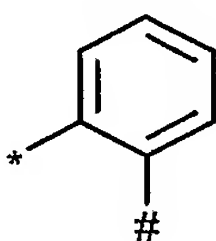
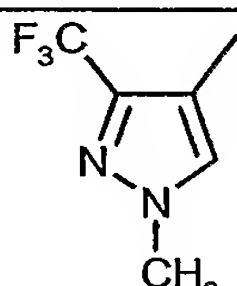
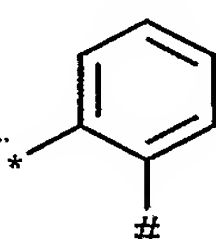
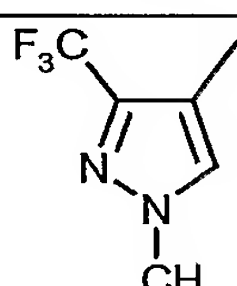
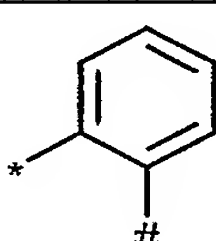
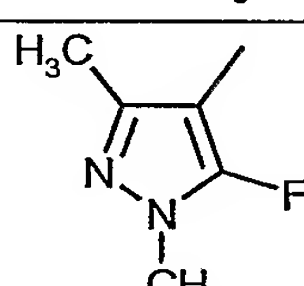
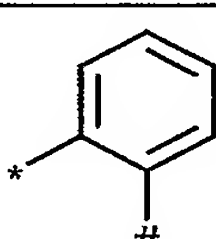
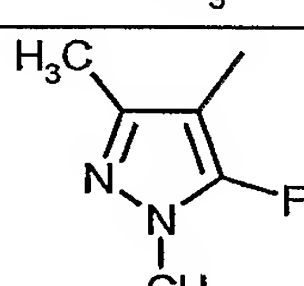
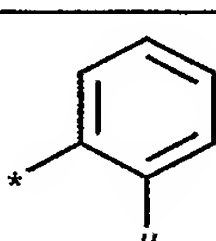
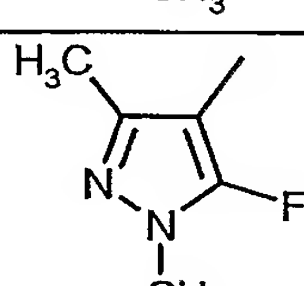
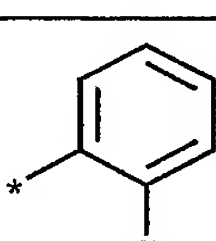
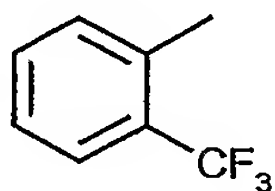
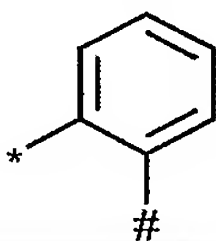
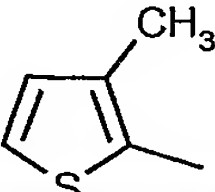
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
11	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		1,66
12	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		2,23
13	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		2,16
14	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		1,46
15	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		2,09
16	H		-CH(CH ₃)-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂		1,86
17	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃) ₂		2,53
18	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃) ₂		3,27
19	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃) ₂		2,98
20	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃) ₂		4,03

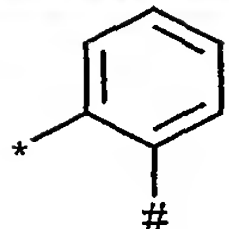
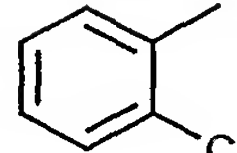
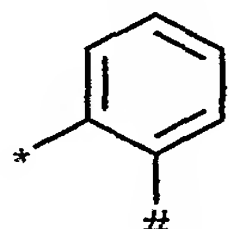
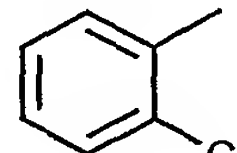
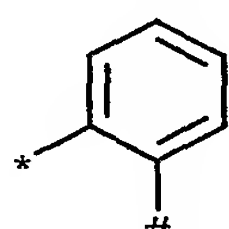
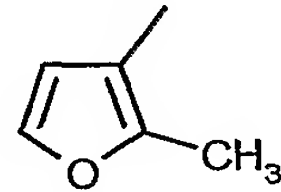
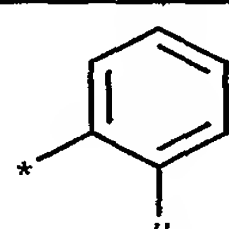
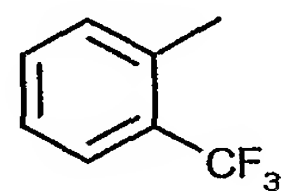
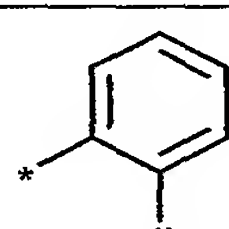
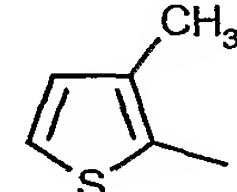
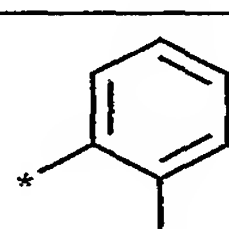
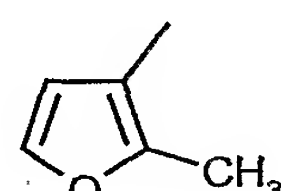
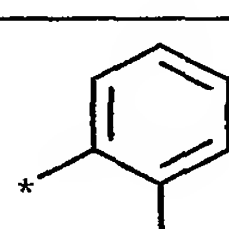
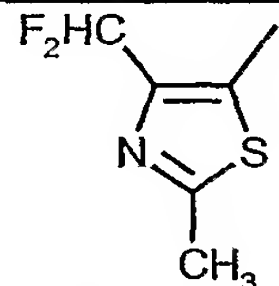
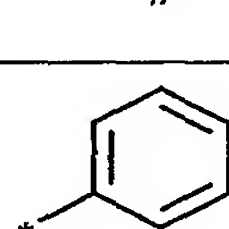
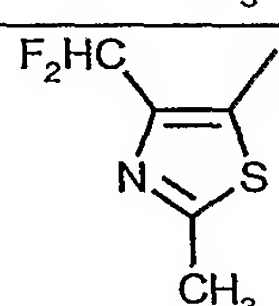
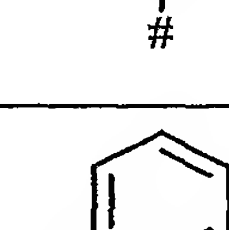
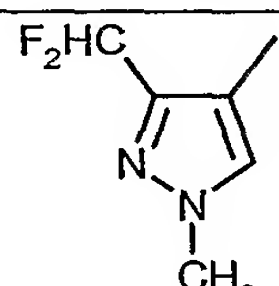
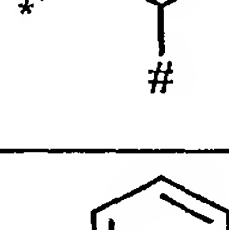
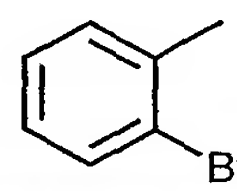
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
21	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃) ₂		3,74
22	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃) ₂		2,95
23	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃) ₂		3,90
24	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃) ₂		3,71
25	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃) ₂		3,73
26	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃) ₂		3,79
27	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃) ₂		3,91
28	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃) ₂		3,01
29	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃) ₂		3,55
30	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃) ₂		3,76
31	H		-CH(CH ₃)-O-CH ₃		2,17

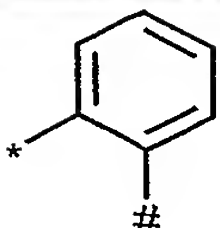
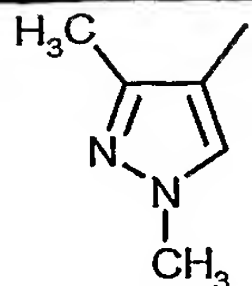
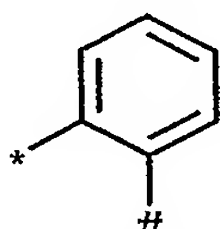
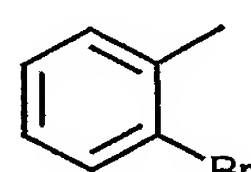
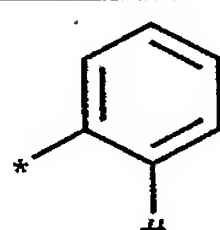
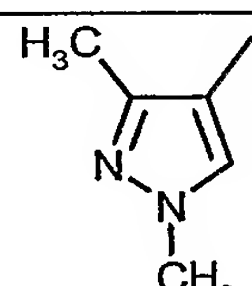
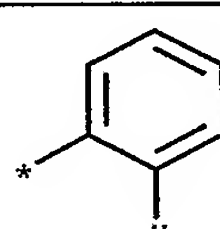
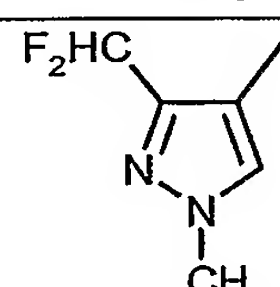
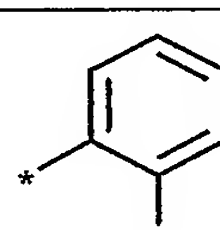
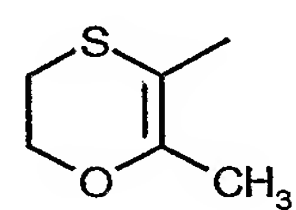
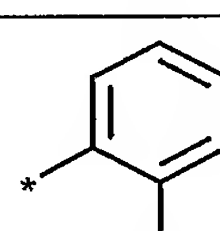
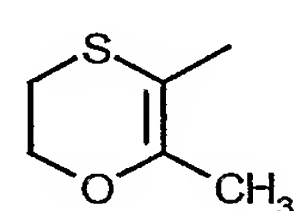
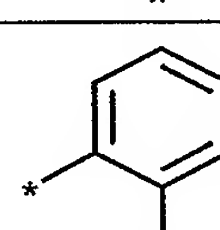
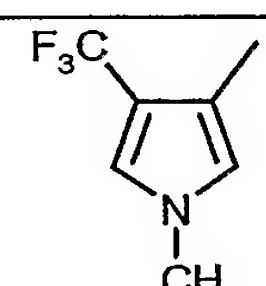
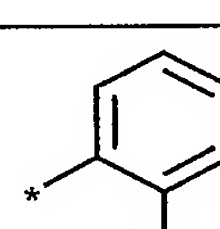
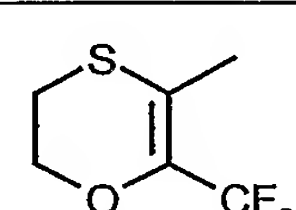
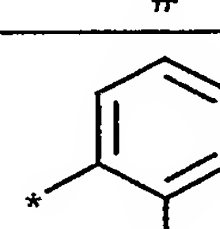
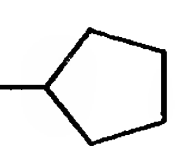
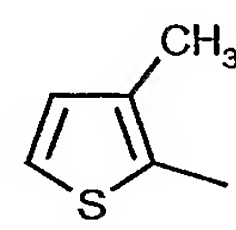
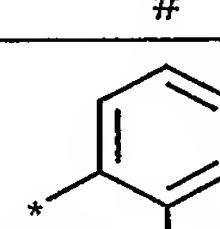
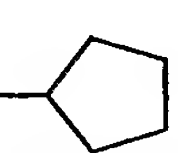
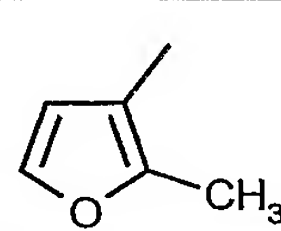
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
32	H		-CH(CH ₃)-O-CH ₃		2,46
33	H		-CH(CH ₃)-O-CH ₃		3,56
34	H		-CH(CH ₃)-O-CH ₃		2,99
35	H		-CH ₂ -S-CH(CH ₃) ₂		3,27
36	H		-CH ₂ -S-CH(CH ₃) ₂		3,05
37	H		-CH ₂ -S-CH(CH ₃) ₂		3,48
38	H		-CH ₂ -S-CH(CH ₃) ₂		2,76
39	H		-CH ₂ -S-CH(CH ₃) ₂		3,68
40	H		-CH(CH ₃)-NH-CH(CH ₃) ₂		0,58
41	H		-CH(CH ₃)-NH-CH(CH ₃) ₂		1,06

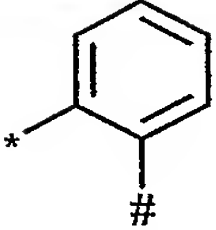
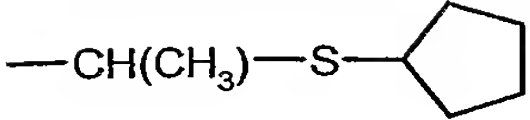
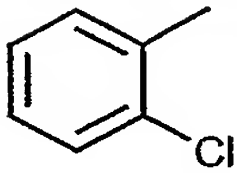
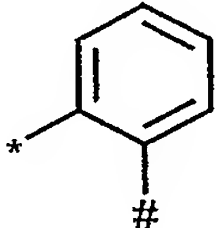
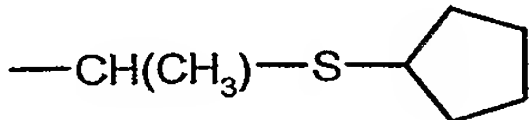
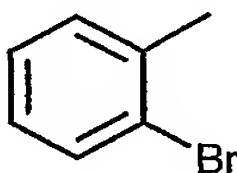
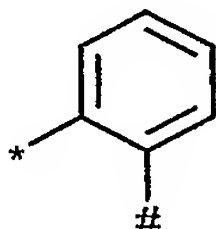
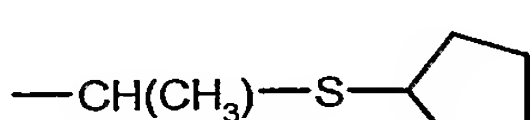
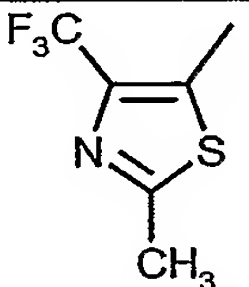
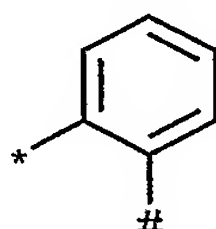
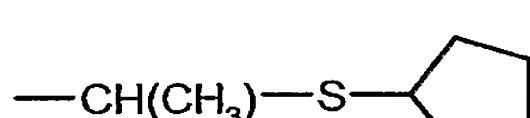
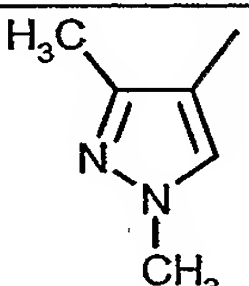
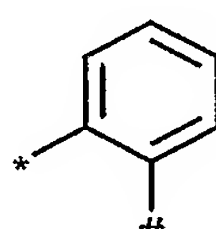
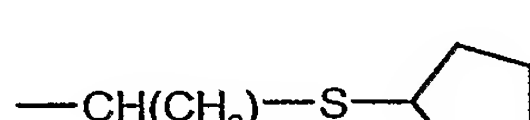
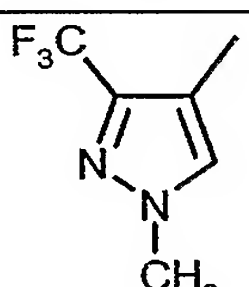
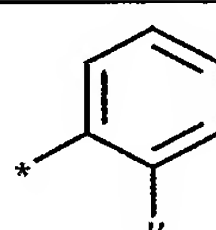
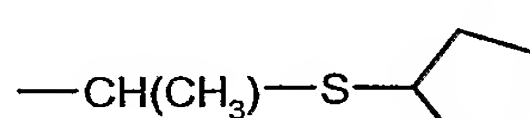
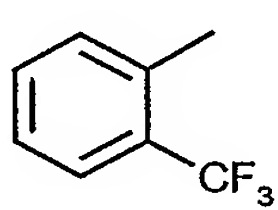
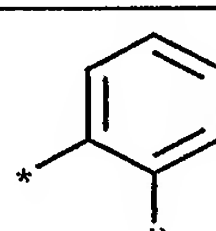
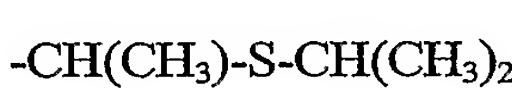
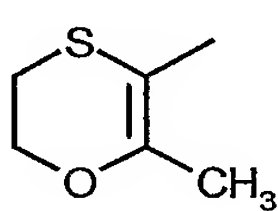
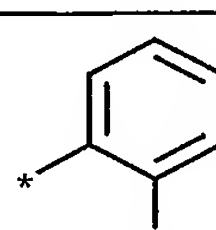
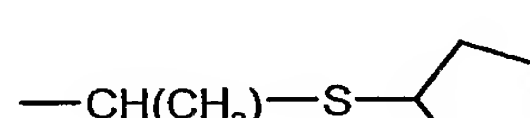
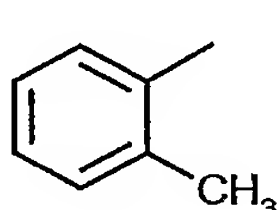
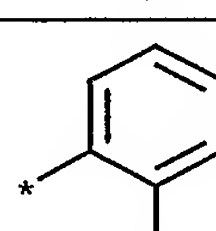
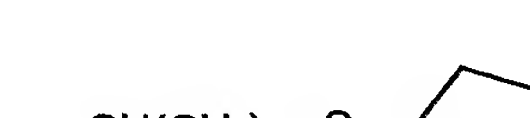
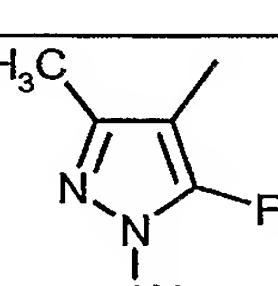
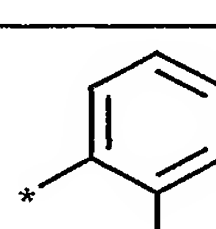

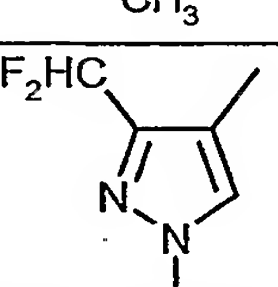
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
42	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		4,02
43	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		3,82
44	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		4,52
45	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		4,14
46	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		3,38
47	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		4,75
48	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		4,12
49	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		4,33
50	H		-CH ₂ -O-C(O)-CHCl ₂		3,15
51	H		-CH ₂ -O-C(O)-CH(CH ₃) ₂		2,39

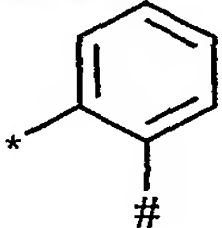

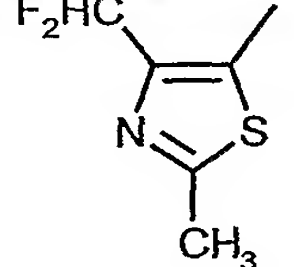
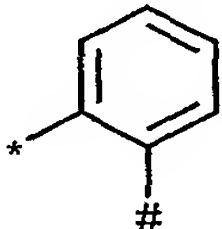
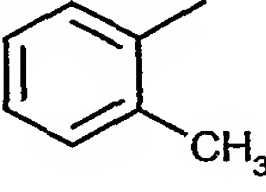
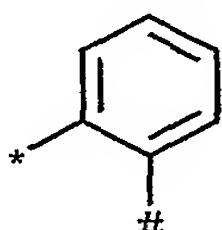
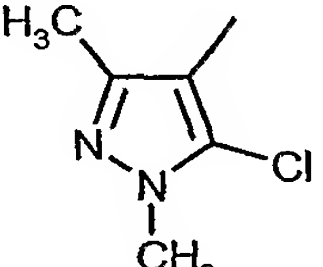
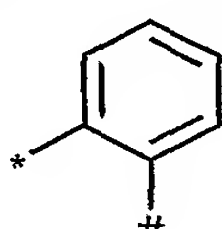
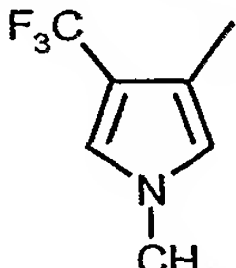
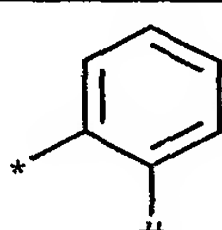
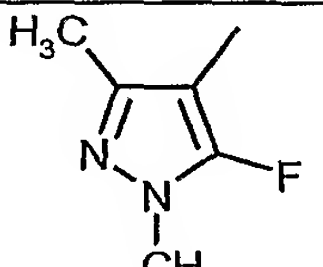
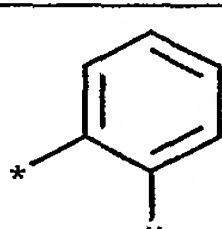

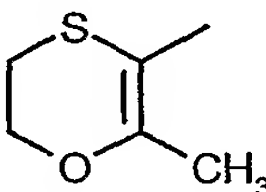
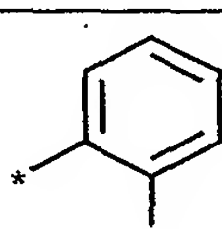
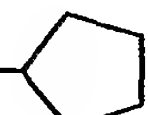
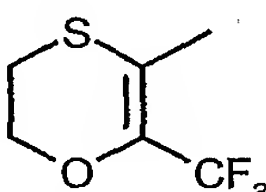
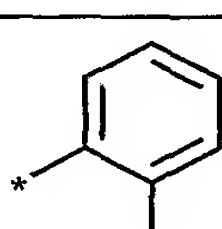
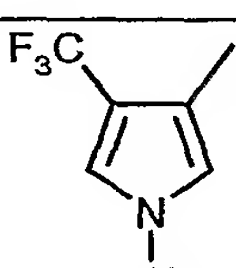
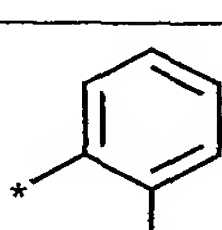
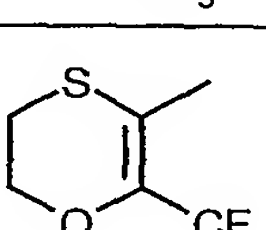
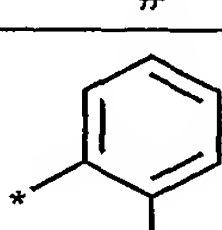
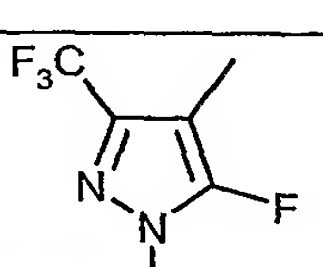
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
52	H		-CH ₂ -O-C(O)-CHCl ₂		2,36
53	H		-CH ₂ -O-C(O)-CH(CH ₃) ₂		3,24
54	H		-CH ₂ -O-CH(CH ₃) ₂		2,51
55	H		-CH ₂ -O-C(O)-CH(CH ₃) ₂		2,74
56	H		-CH ₂ -O-C(O)-CHCl ₂		2,69
57	H		-CH ₂ -O-C(O)-CH(CH ₃) ₂		2,38
58	H		-CH ₂ -O-C(O)-CHCl ₂		2,38
59	C(O)i-Pr		-CH ₂ -O-C(O)-CH(CH ₃) ₂		3,49
60	H		-CH ₂ -O-CH(CH ₃) ₂		2,85
61	H		-(CH ₂) ₂ C(CH ₃) ₂ -O-C(O)-CH ₃		3,30

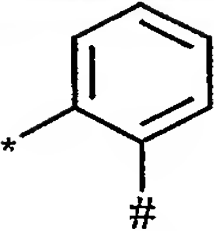
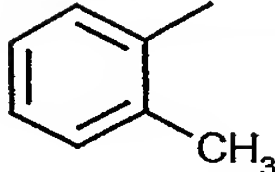
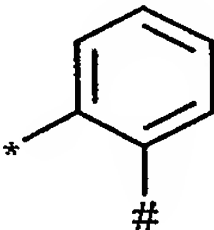
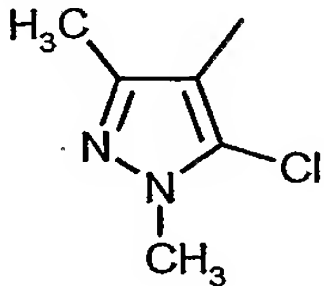
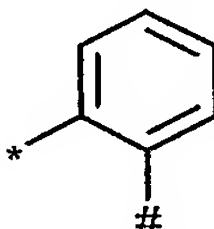
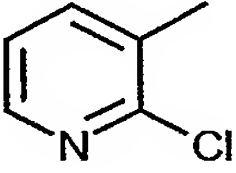
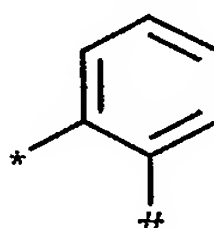
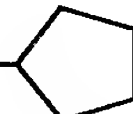
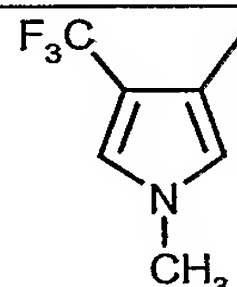
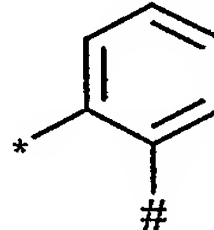
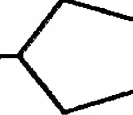
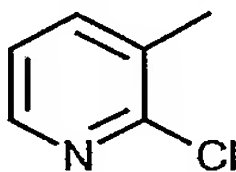
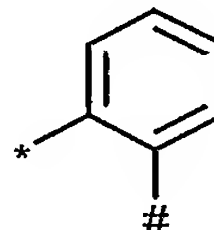
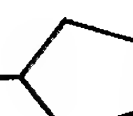
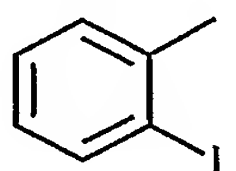
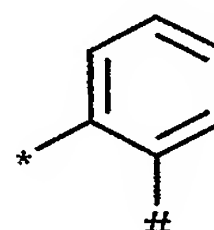
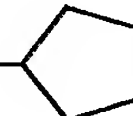
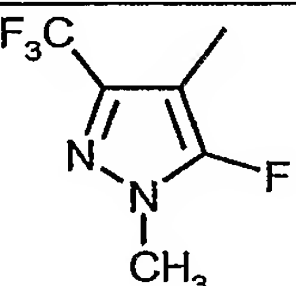
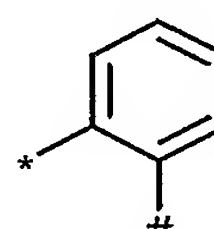
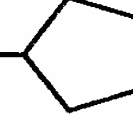
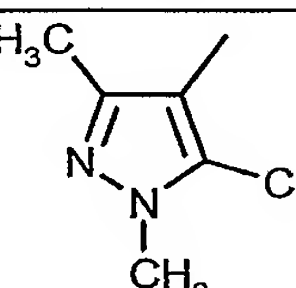
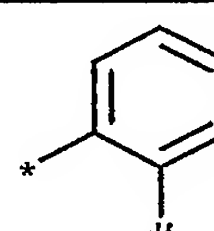
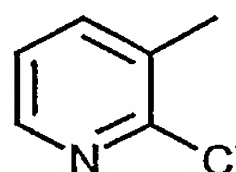
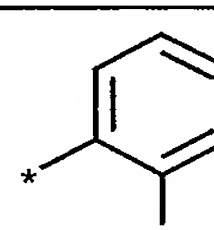
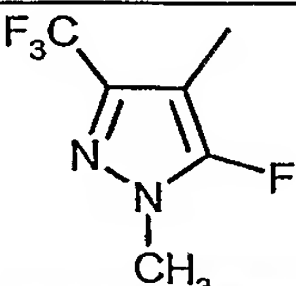
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
62	H		-(CH ₂) ₂ OH		1,62
63	H		-(CH ₂) ₂ OH		1,21
64	H		-(CH ₂) ₂ -O-C(O)-CH(CH ₃) ₂		2,79
65	H		-(CH ₂) ₂ -O-Si(CH ₃) ₂ -C(CH ₃) ₃		4,59
66	H		-(CH ₂) ₂ -O-C(O)-CHCl ₂		2,76
67	H		-(CH ₂) ₂ -O-C(O)-CH(CH ₃) ₂		2,40
68	H		-(CH ₂) ₂ -O-C(O)-CHCl ₂		2,43
69	H		-(CH ₂) ₂ -O-Si(CH ₃) ₂ -C(CH ₃) ₃		4,49
70	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		4,71
71	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		4,93

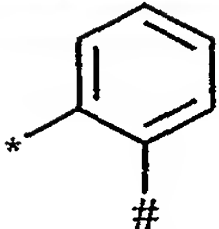
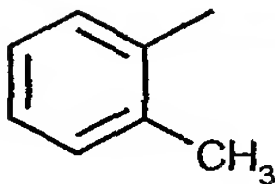
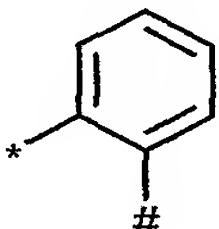
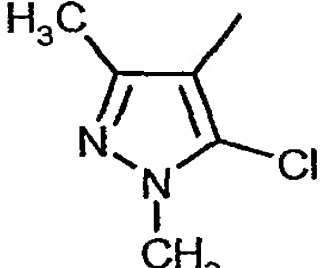
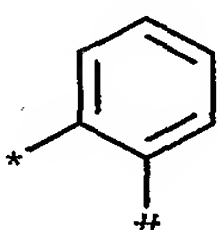
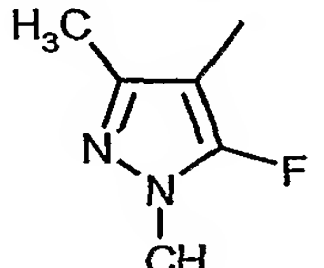
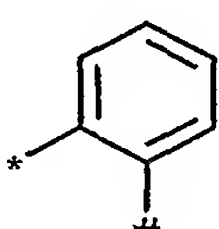
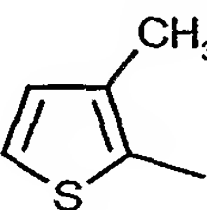
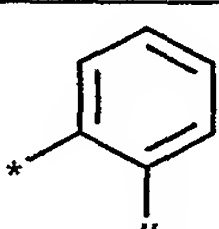
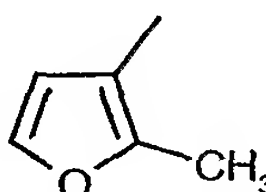
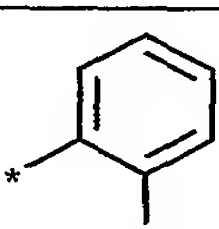
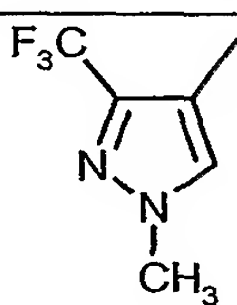
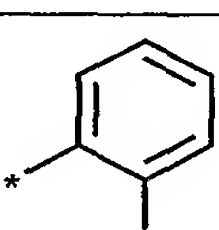
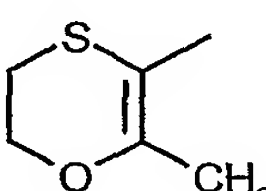
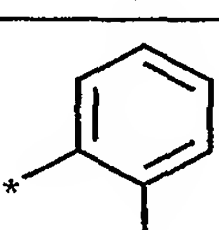
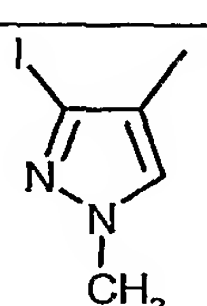
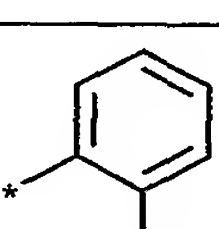
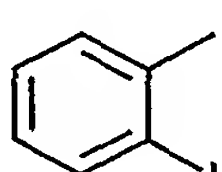
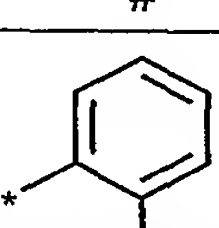
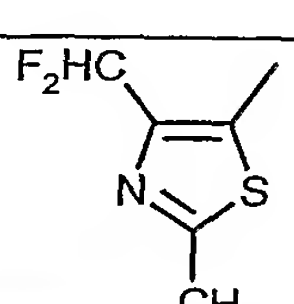
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
72	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		4,60
73	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		4,17
74	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		4,17
75	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		4,31
76	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		4,47
77	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		4,61
78	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		3,95
79	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		4,36
80	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		3,38
81	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		4,63

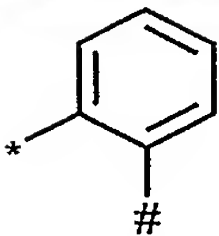
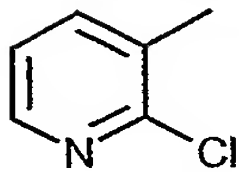
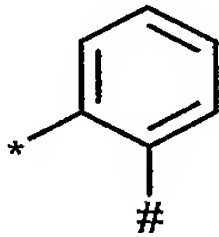
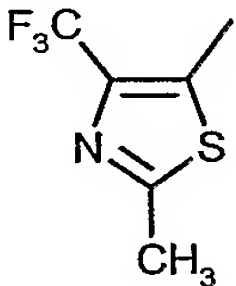
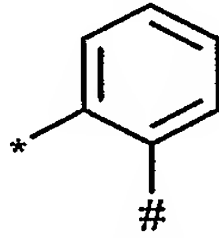
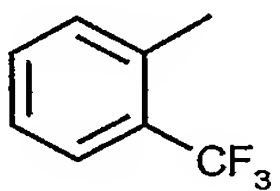
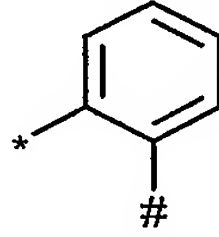
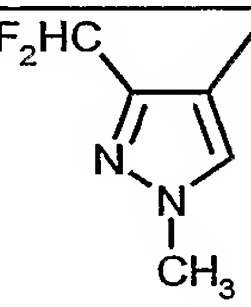
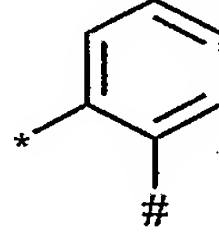
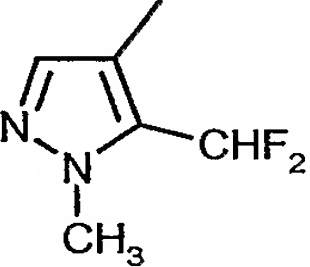
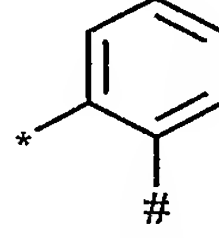
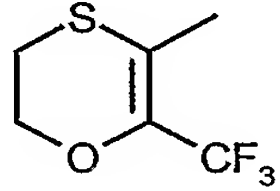
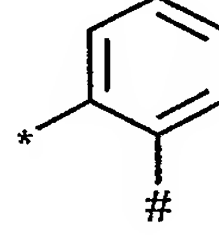
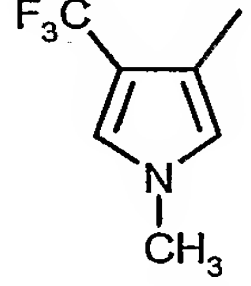
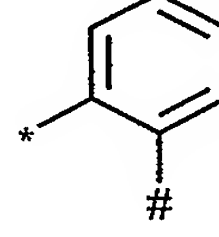
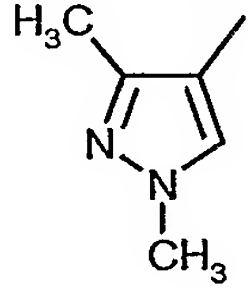
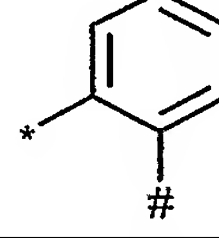
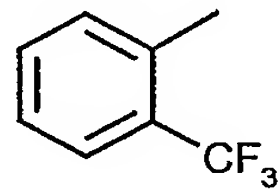
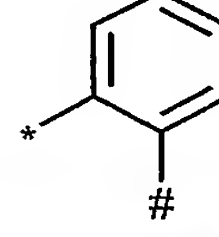
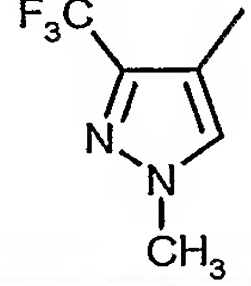
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
82	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		3,27
83	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		4,21
84	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		2,90
85	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		3,76
86	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		4,07
87	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		4,53
88	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		3,92
89	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		4,10
90	H		-CH(CH ₃)-S- 		3,16
91	H		-CH(CH ₃)-S- 		4,31

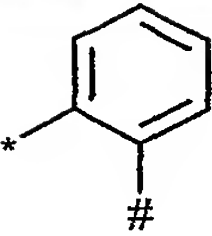
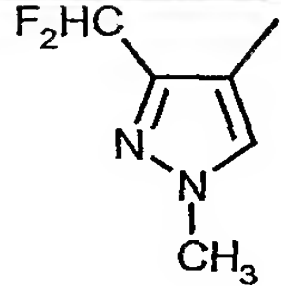
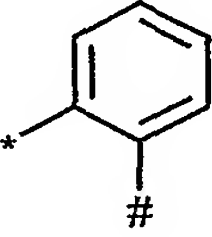
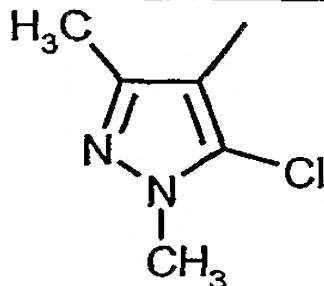
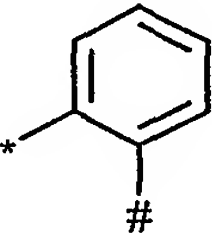
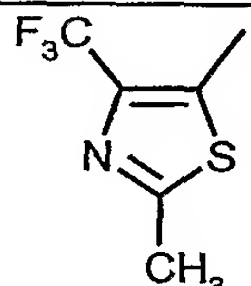
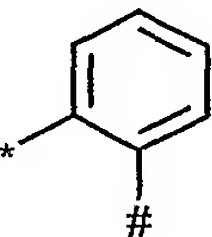
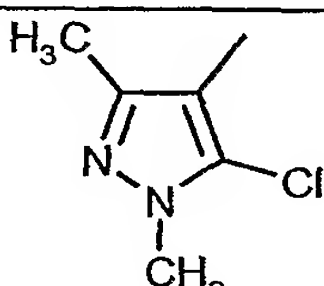
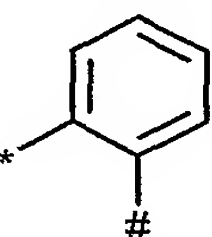
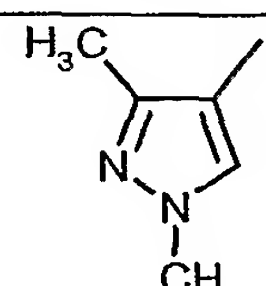
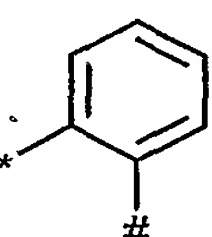
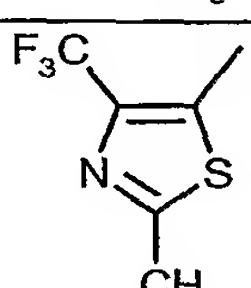
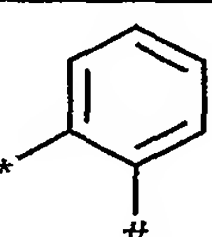
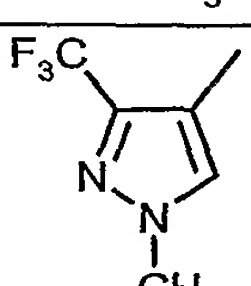
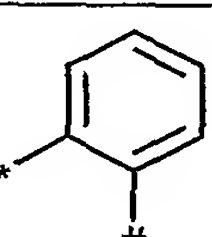
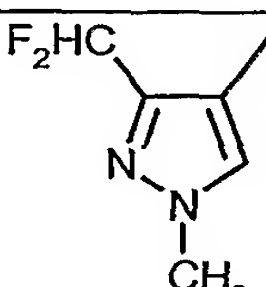
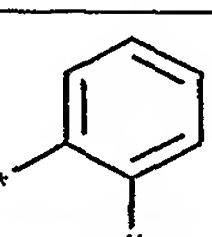
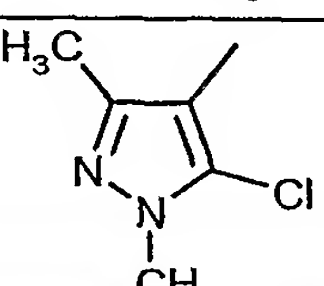
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
92	H				4,29
93	H				4,34
94	H				4,24
95	H				3,04
96	H				3,76
97	H				4,41
98	H				3,65
99	H				4,44
100	H				4,03
101	H				3,48

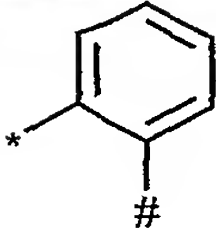
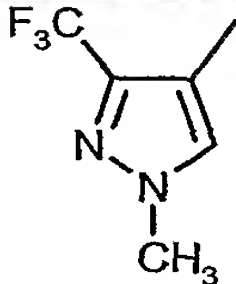
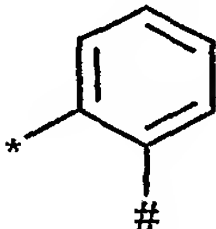
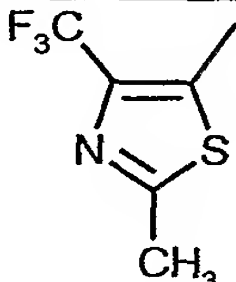
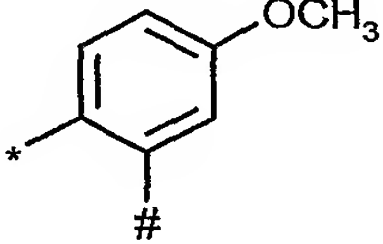
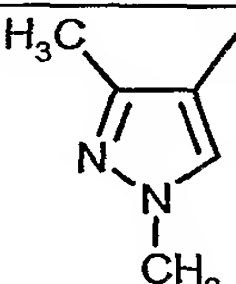
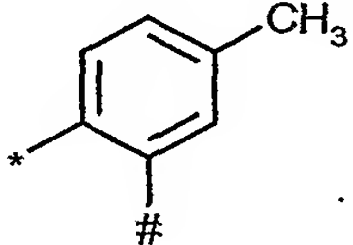
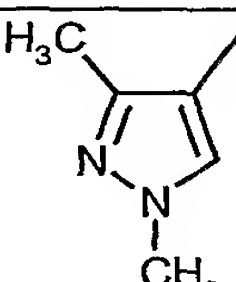
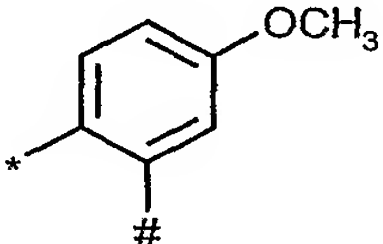
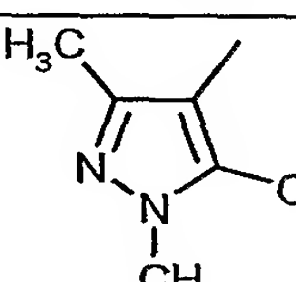
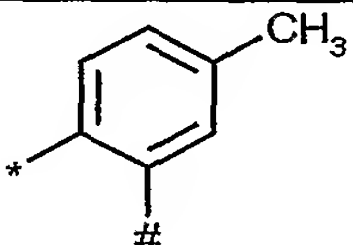
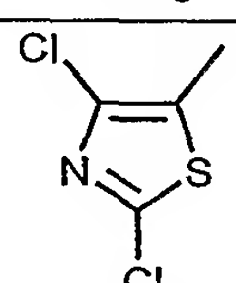
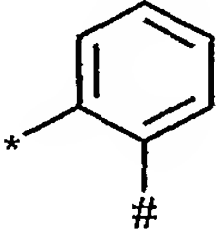
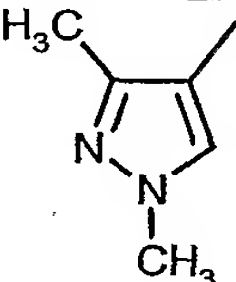
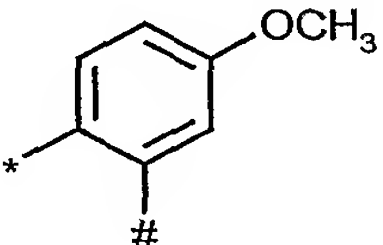
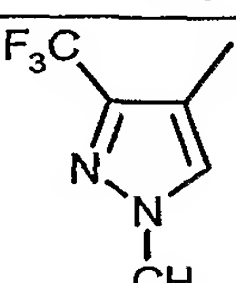
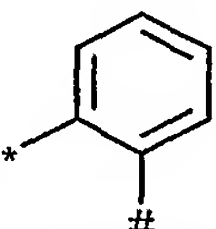
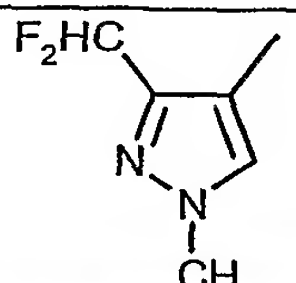
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
102	H		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$ 		4,07
103	H		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$		3,88
104	H		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$		3,20
105	H		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$		3,57
106	H		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$		3,63
107	H		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$ 		4,24
108	H		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$ 		4,21
109	H		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$		4,29
110	H		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$		4,49
111	H		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$		4,38

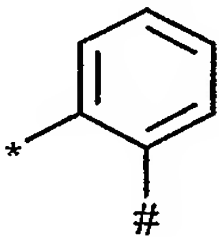
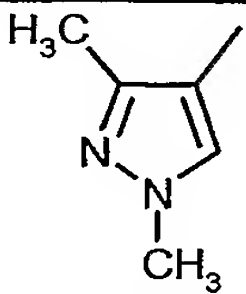
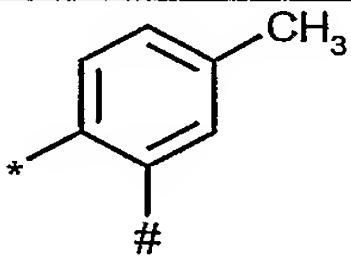
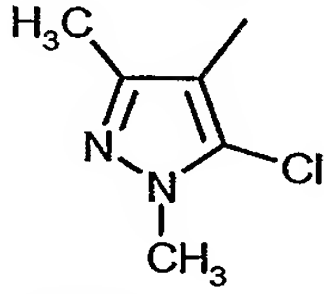
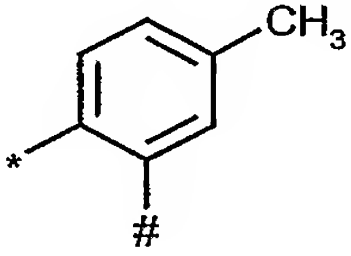
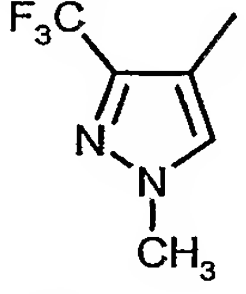
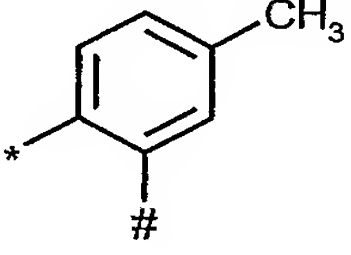
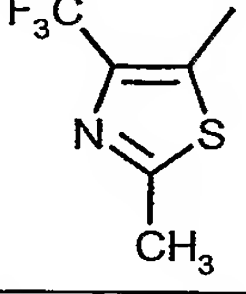
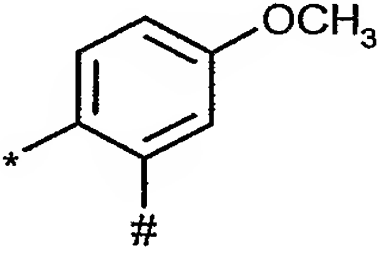
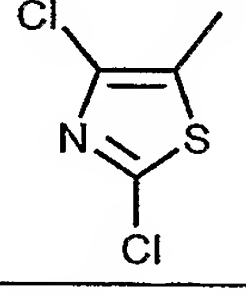
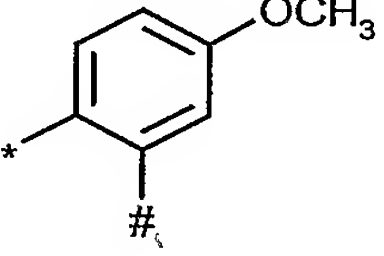
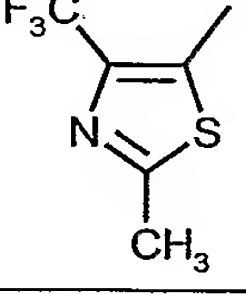
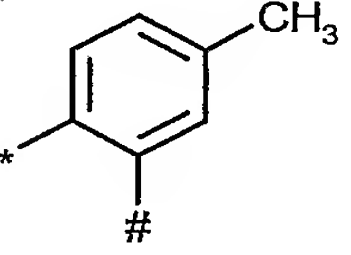
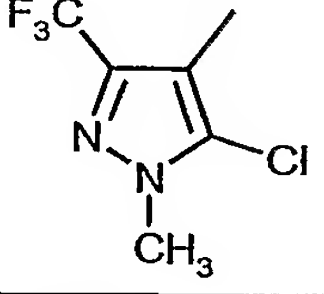
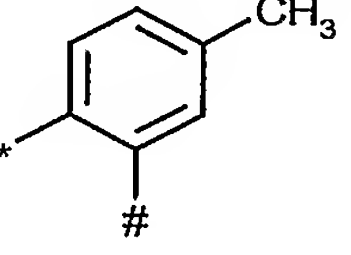
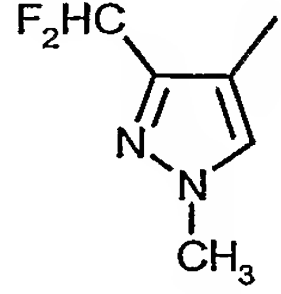
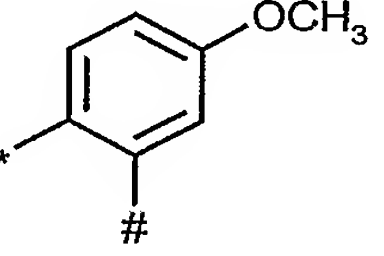
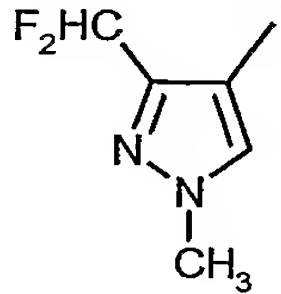
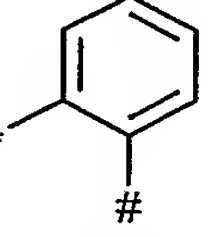
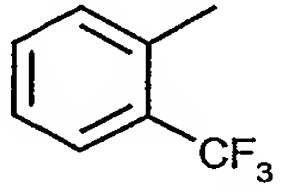
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
112	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		4,76
113	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		4,07
114	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃		3,79
115	H		-CH(CH ₃)-S- 		4,02
116	H		-CH(CH ₃)-S- 		3,46
117	H		-CH(CH ₃)-S- 		4,45
118	H		-CH(CH ₃)-S- 		4,12
119	H		-CH(CH ₃)-S- 		3,76
120	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		3,35
121	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		3,99

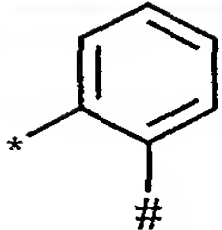
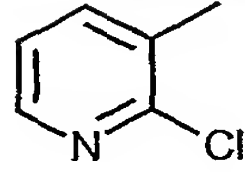
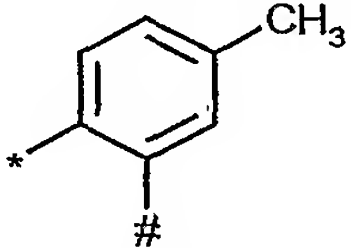
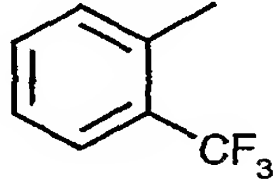
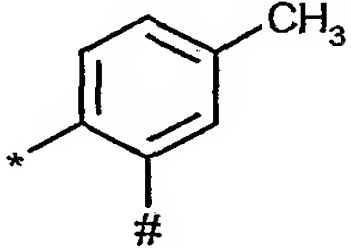
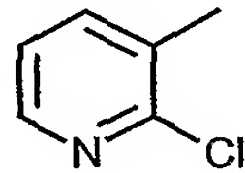
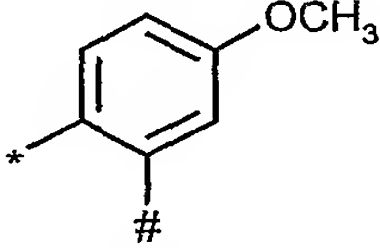
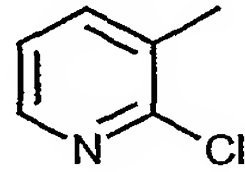
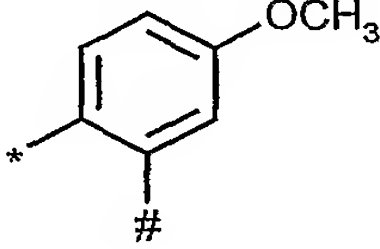
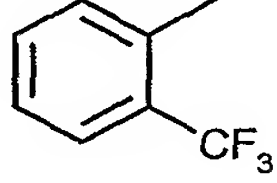
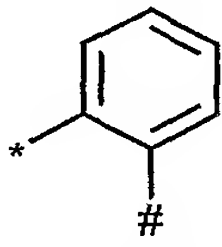
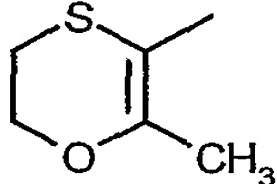
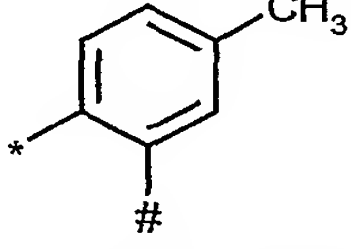
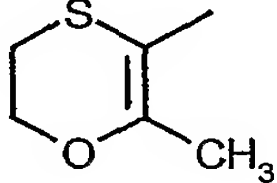
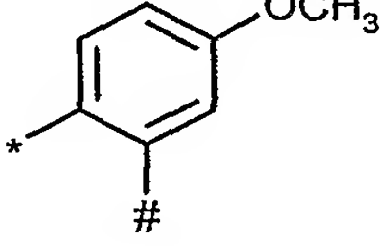
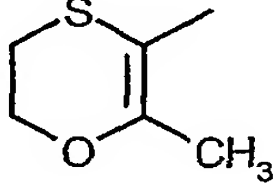
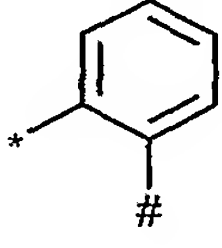
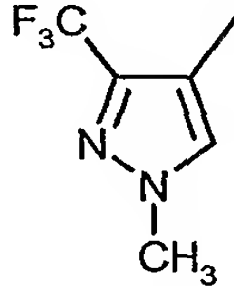
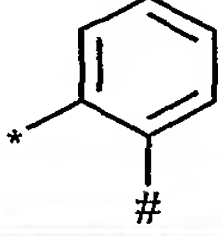
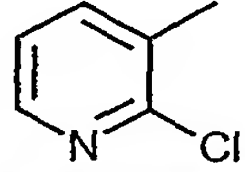
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
122	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		4,31
123	H		-CH(CH ₃)-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃		3,60
124	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		2,90
125	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		4,50
126	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		3,80
127	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		3,14
128	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		3,47
129	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		2,75
130	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		3,83
131	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		3,58

Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
132	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		2,72
133	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		3,65
134	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		3,81
135	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		2,89
136	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		3,67
137	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		3,64
138	H		-CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂		5,60
139	H		-CH ₂ -N(CH ₃) ₂		98°C
140	H		-CH ₂ -N(CH ₃) ₂		
141	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		

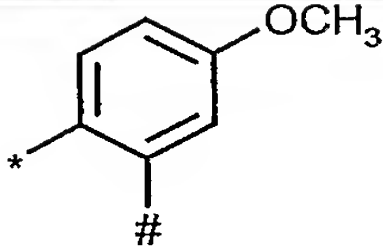
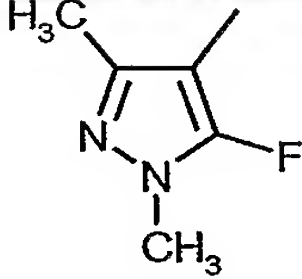
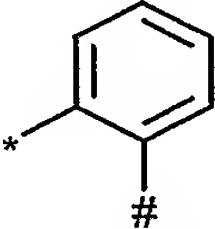
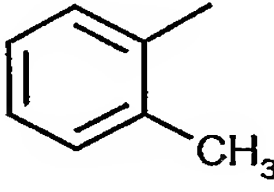
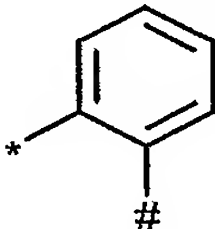
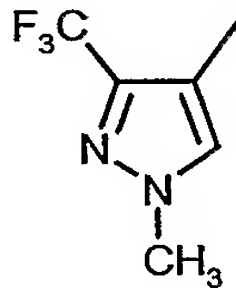
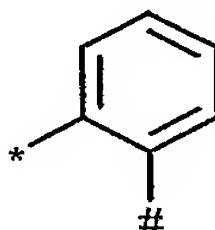
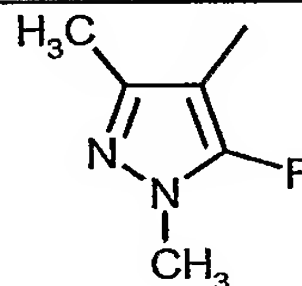
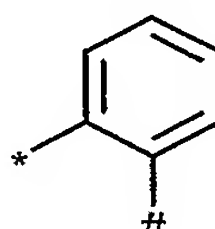
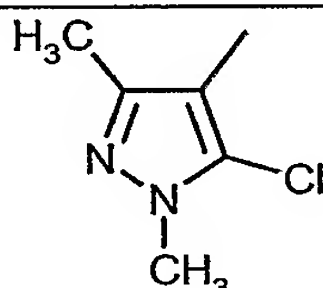
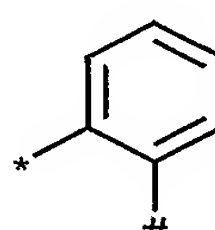
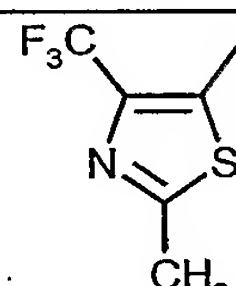
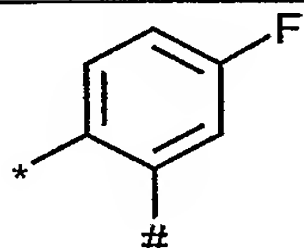
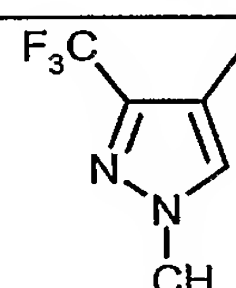
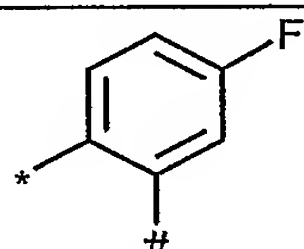
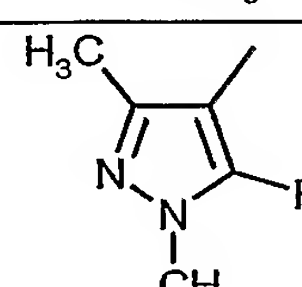
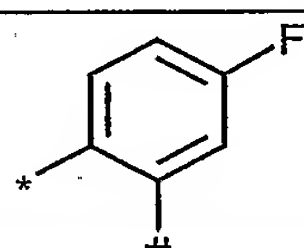
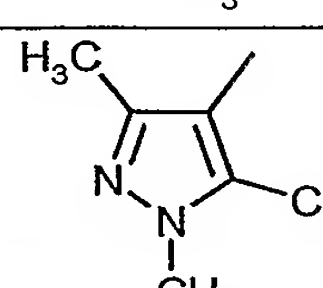
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
142	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		103°C
143	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		96°C
144	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		
145	H		-CH ₂ -SO-CH ₂ CH ₃		
146	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		105°C
147	H		-CH ₂ -SO-CH ₂ CH ₃		
148	H		-CH ₂ -SO-CH ₂ CH ₃		
149	H		-CH ₂ -SO-CH ₂ CH ₃		
150	H		-CH ₂ -SO ₂ -CH ₂ CH ₃		148°C

Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
151	H		-CH ₂ -SO ₂ -CH ₂ CH ₃		135°C
152	H		-CH ₂ -SO ₂ -CH ₂ CH ₃		142°C
153	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		142°C
154	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		116°C
155	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		125°C
156	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		72°C
157	H		-CH ₂ -SO ₂ -CH ₂ CH ₃		
158	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		135°C
159	H		-CH ₂ -SO ₂ -CH ₂ CH ₃		143°C

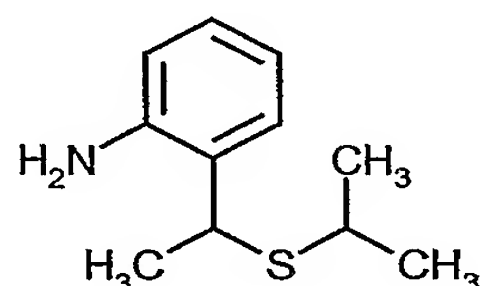
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
160	H		-CH ₂ -SO-CH ₂ CH ₃		
161	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		127°C
162	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		
163	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		
164	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		116°C
165	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		98°C
166	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		132°C
167	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		86°C
168	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		110°C
169	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		79°C

Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
170	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		75°C
171	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		105°C
172	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		112°C
173	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		138°C
174	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		120°C
175	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		71°C
176	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		
177	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		68°C
178	H		-CH ₂ -OH		1,61
179	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH(CH ₃) ₂		92°C

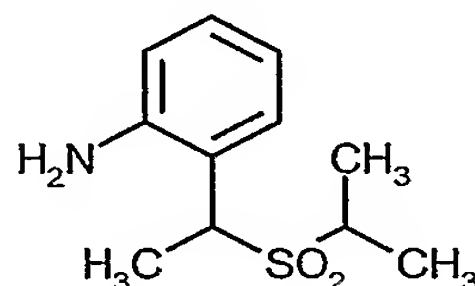
Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
180	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH(CH ₃) ₂		
181	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH(CH ₃) ₂		86°C
182	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH(CH ₃) ₂		82°C
183	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH(CH ₃) ₂		45°C
184	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH(CH ₃) ₂		
185	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH(CH ₃) ₂		
186	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH(CH ₃) ₂		94°C
187	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH(CH ₃) ₂		77°C
188	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		96°C
189	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH(CH ₃) ₂		

Nr.	R ¹	M	-L ¹ QL ² R	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
190	H		-CH ₂ -S-CH ₂ CH ₃		147°C
191	H		-CH ₂ -S-CH ₃		
192	H		-CH(CH ₃)-S-CH ₂ CH ₃		
193	H		-CH(CH ₃)-S-CH ₂ CH ₃		
194	H		-CH(CH ₃)-S-CH ₂ CH ₃		
195	H		-CH(CH ₃)-S-CH ₂ CH ₃		
196	H		-CH(CH ₃)-S-CH ₂ CH ₃		
197	H		-CH(CH ₃)-S-CH ₂ CH ₃		
198	H		-CH(CH ₃)-S-CH ₂ CH ₃		

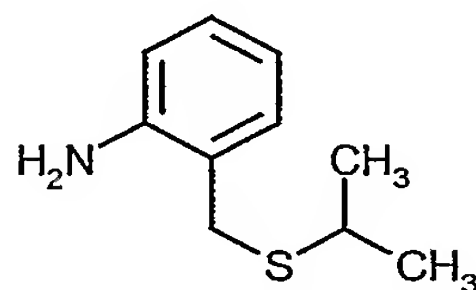
^{a)} Die mit „*“ markierte Bindung ist mit dem Amid verknüpft.

Herstellung der Ausgangsstoffe der Formel (III)**Beispiel (III-1)**

- 5 44 g (0,188 mol) 1-[1-(Isopropylthio)ethyl]-2-nitrobenzol (VII-1) werden in 250 ml Ethanol gelöst, mit 3 g Raney-Nickel versetzt und im Autoklav bei Raumtemperatur 6 Stunden mit 3 bar Wasserstoff hydriert. Nach 6 Stunden werden erneut 3 g Raney-Nickel hinzugegeben und weitere 16 Stunden bei Raumtemperatur mit 3 bar Wasserstoff hydriert. Zur Aufarbeitung wird vom Katalysator abfiltriert und das Lösungsmittel in Vakuum entfernt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch gereinigt
- 10 (Kieselgel, Hexan/Methyl-tert-butylether 3:1). Man erhält 32 g (Gehalt 97,3 %, HPLC, 84,4 % der Theorie) an 2-[1-(Isopropylthio)ethyl]anilin in Form eines gelben Öls [$\log P$ (pH 2,3) = 2,45].

Beispiel (III-2)

- 15 In einem 500 ml Dreihalskolben mit Rührer und Thermometer werden 16,2 g (60,5 mmol) 1-[1-(Isopropylsulfonyl)ethyl]-2-nitrobenzol (VII-4) in 160 ml Methanol vorgelegt, unter Rühren mit 160 ml konzentrierter Salzsäure versetzt und bei 20-40°C portionsweise 31,5 g Zinnpulver (265,2 mmol) zugegeben. Die Mischung wird bei 40°C ca. 1 Stunde nachgerührt. Zur Aufarbeitung wird abgekühlt, filtriert und mit 1575 ml einer eisgekühlten 10%igen Natronlauge verrührt. Man extrahiert zweimal
- 20 mit Dichlormethan, trocknet über Natriumsulfat und zieht das Lösungsmittel im Vakuum ab. Man erhält 13,3 g (Gehalt 95,8 %, HPLC, 92,6 % der Theorie) an 2-[1-(Isopropylsulfonyl)ethyl]anilin [$\log P$ (pH 2,3) = 1,28].

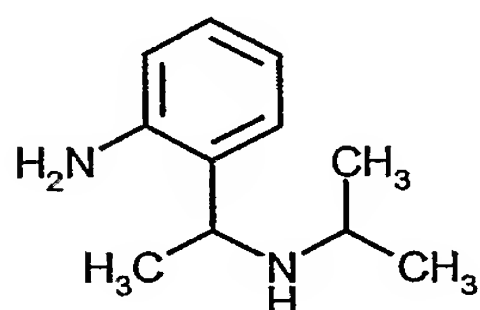
Beispiel (III-3)

25

In einem 500 ml Dreihalskolben mit Rührer und Thermometer werden 11,8 g (55,6 mmol) 1-[1-(Isopropylthio)methyl]-2-nitrobenzol (VII-2) in 150 ml Methanol vorgelegt, unter Rühren mit 150 ml konzentrierter Salzsäure versetzt und bei 20-40°C portionsweise 17,6 g Zinnpulver (148,5 mmol) zu-

gegeben. Die Mischung wird bei 40°C für ca. 1 Stunde nachgerührt. Zur Aufarbeitung wird abgekühlt, filtriert und mit 1300 ml einer eisgekühlten 10%igen Natronlauge verrührt. Man extrahiert zweimal mit Dichlormethan, trocknet über Natriumsulfat und verdampft das Lösungsmittel im Vakuum. Das Rohprodukt wird mit Hexan/Methyl-tert-butylether 3:1 an Kieselgel gereinigt. Man erhält 4,6 g (Gehalt 94,6 %, HPLC, 43,2 % der Theorie) an 2-[(Isopropylthio)methyl]anilin in Form eines gelben Öls [$\log P$ (pH 2,3) = 1,94].

Beispiel (III-4)

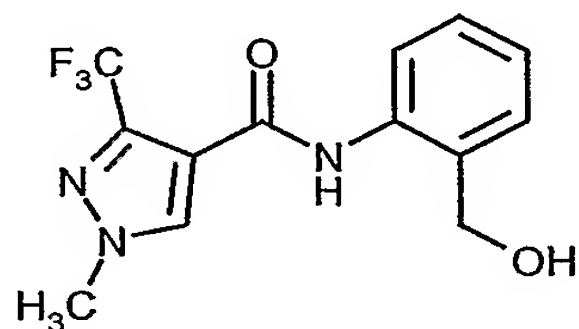


10 In einem Autoklav wird eine Lösung von 5 g N-[1-(2-Nitrophenyl)ethyl]propan-2-amin (VII-5) (24 mmol) in 30 ml Methanol mit 0,5 g Raney-Nickel versetzt und 5 Stunden bei 50°C und 50 bar Wasserstoff hydriert. Zur Aufarbeitung wird abgekühlt, der Katalysator abfiltriert und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Man erhält 2,8 g (Gehalt 98,1 %, 64,2 % der Theorie) an 2-[1-(Isopropylamino)ethyl]anilin [$\log P$ (pH 2,3) = 0,05].

15

Herstellung der Ausgangsstoffe der Formel (IV)

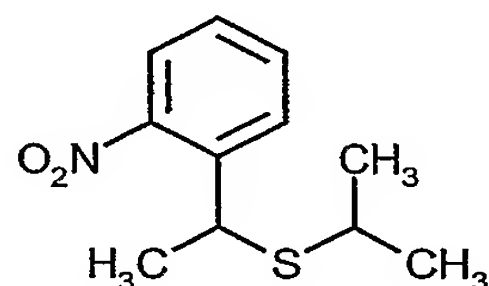
Beispiel (IV-1)



20

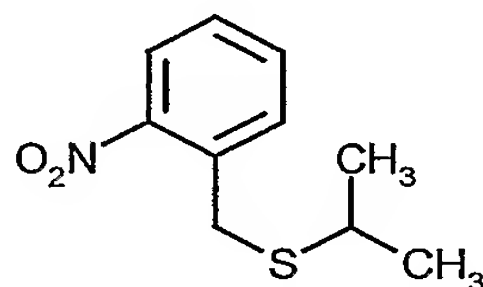
Bei Raumtemperatur wird eine Lösung bestehend aus 34,5 g (0,16 Mol) 1-Methyl-3-trifluoromethyl-1H-pyrazol-4-carbonsäurechlorid in 50 ml Tetrahydrofuran zu einer Lösung bestehend aus 20,0 g (0,16 Mol) (2-Amino-phenyl)-methanol und 36 ml (0,26 Mol) Triethylamin in 250 ml Tetrahydrofuran getropft. Nach Abklingen der exothermen Wärmetönung wird für 6 Stunden rückflusiert und weitere 48 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Die Reaktionsmischung wird auf ca. 250 ml Wasser gegeben, mit Essigsäureethylester extrahiert, mit 2 N Salzsäure gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und im Vakuum aufkonzentriert. Säulenchromatographie (Gradient Cyclohexan/Essigsäureethylester) liefert 33,8 g (69 % der Theorie) an N-[2-(Hydroxymethyl)phenyl]-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid [$\log P$ (pH 2,3) = 1,55].

30

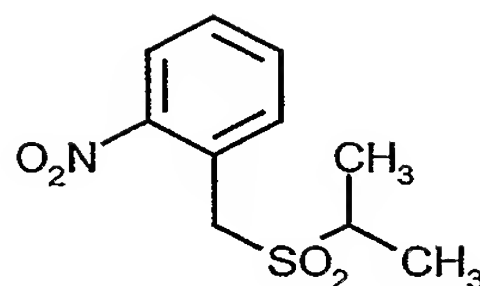
Herstellung der Ausgangsstoffe der Formel (VII)**Beispiel (VII-1)**

- 5 In einem 1 Liter-Dreihalskolben mit Rührer, Tropftrichter und Thermometer werden 34,8 g (0,354 mol) Natrium-2-propanthiolat in 450 ml Acetonitril vorgelegt und bei einer Temperatur von 30-40°C 63 g 1-(1-Chlorethyl)-2-nitrobenzol (VIII-1) (Gehalt 99,4 %, 0,337 mol) in 20 ml Acetonitril gelöst zugetropft. Die Suspension wird noch 16 Stunden bei 40°C nachgerührt, abgekühlt und das Lösungsmittel im Vakuum abgezogen. Der verbleibende Rückstand wird in Dichlormethan aufgenom-
- 10 men, gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch gereinigt (Kieselgel, Hexan/Aceton 29:1). Man erhält 48 g (Gehalt 98,8 %, HPLC, 62,4 % der Theorie) an 1-[1-(Isopropylthio)ethyl]-2-nitrobenzol in Form eines gelben Öls [$\log P$ (pH 2,3) = 3,89].

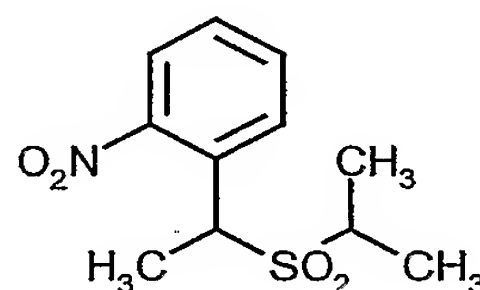
15 **Beispiel (VII-2)**



- In einem 250 ml Dreihalskolben mit Rührer, Tropftrichter und Thermometer werden 10,3 g (0,105 mol) Natrium-2-propanthiolat in 75 ml Acetonitril vorgelegt und unter Kühlung bei 30-40°C eine Lösung von 17,2 g (0,1 mol) 2-Nitrobenzylchlorid in 20 ml Acetonitril zugetropft. Die Suspension wird 16 Stunden bei 40-50 °C nachgerührt. Zur Vervollständigung der Umsetzung werden noch 6 g Natrium-2-propanthiolat (0,061 mol) zugesetzt und weitere 24 Stunden bei 40-50°C gerührt. Zur Aufarbeitung wird abgekühlt und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Der Rückstand wird in Methyl-tert-butylether aufgenommen, gewaschen und über Natriumsulfat getrocknet. Das Natriumsulfat wird abfiltriert und die Lösung im Vakuum eingeeengt. Das Rohprodukt wird säulenchromato-
- 25 graphisch gereinigt (Kieselgel, Cyclohexan/Essigsäureethylester 50:1). Man erhält 11,8 g (Gehalt 92 %, HPLC, 51,2 % der Theorie) an 1-[1-(Isopropylthio)methyl]-2-nitrobenzol in Form eines braunen Öls [$\log P$ (pH 2,3) = 3,28].

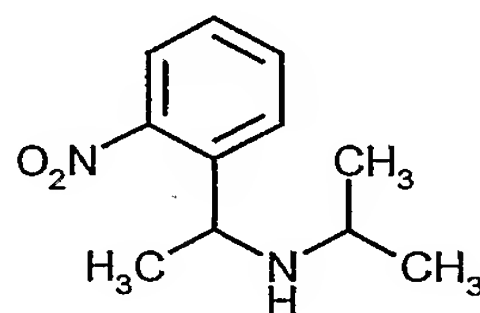
Beispiel (VII-3)

In einem 1 Liter-Dreihalskolben mit Rührer, Tropftrichter und Thermometer werden 32,8 g 1-[1-(Isopropylthio)methyl]-2-nitrobenzol (VII-2) (0,155 mol) in 465 ml Dichlormethan vorgelegt und unter
 5 Rühren nacheinander 14,3 g Ameisensäure (0,31 mol) und 1,6 g Ammoniummolybdat zugegeben. Unter schnellem Rühren werden bei Raumtemperatur 45,3 g (0,466 mol) 35%ige wässrige Wasserstoffperoxidlösung zugetropft. Die Mischung wird 16 Stunden nachgerührt. Zur Aufarbeitung wird die organische Phase abgetrennt, jeweils einmal mit verdünnter Natriumhydrogensulfit-Lösung und mit Wasser gewaschen und die organische Lösung über Natriumsulfat getrocknet. Das Lösungsmittel
 10 wird im Vakuum abdestilliert und der Rückstand mit Diethylether verrührt, das ausgefallene Produkt abgesaugt und getrocknet. Man erhält 30,5 g (Gehalt 99 %, HPLC, 80 % der Theorie) an 1-[(Isopropylsulfonyl)methyl]-2-nitrobenzol in Form eines gelben Feststoffes [$\log P$ (pH 2,3) = 1,63].

Beispiel (VII-4)

15 In einem 1 Liter-Dreihalskolben mit Rührer und Thermometer werden 18,9 g (77,7 mmol) 1-[(Isopropylsulfonyl)methyl]-2-nitrobenzol (VII-3) in 390 ml Acetonitril vorgelegt und nacheinander 90,1 g (652 mmol) Kaliumcarbonat, 0,26 g 18-Krone-6 und 12,1 g (85,5 mmol) Iodmethan zugegeben. Man rührt 4 Stunden unter Rückfluss, setzt dann noch 2,5 g Iodmethan (17,6 mmol) nach und rührt weitere
 20 4 Stunden unter Rückfluss. Zur Aufarbeitung wird abgekühlt und im Vakuum eingeeengt. Der Rückstand wird in Essigsäureethylester aufgenommen, mit Wasser gewaschen und über Natriumsulfat getrocknet. Nach dem Abziehen des Lösungsmittels wird das Rohprodukt säulenchromatographisch gereinigt (Kieselgel, Hexan/Aceton 7:3). Man erhält 16,2 g (Gehalt 96,1 %, HPLC, 77,9 % der Theorie) an 1-[1-(Isopropylsulfonyl)ethyl]-2-nitrobenzol [$\log P$ (pH 2,3) = 1,99].

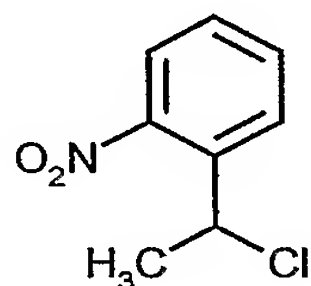
25

Beispiel (VII-5)

In einem Autoklav werden 13,8 g 1-(1-Chlorethyl)-2-nitrobenzol (VIII-1) (98,3%ig, 73,1 mmol) und 43,2 g Isopropylamin (731 mmol) 24 Stunden bei 60°C und Eigendruck gerührt. Nach dem Abkühlen des Reaktionsgemisches wird das überschüssige Isopropylamin im Vakuum entfernt und das Rohprodukt mit Cyclohexan/Essigsäureethylester 4:1 an Kieselgel gereinigt. Man erhält 5 g (Gehalt 94,4 %, 31 % der Theorie) an N-[1-(2-Nitrophenyl)ethyl]propan-2-amin in Form eines Öls [logP (pH 2,3) = 0,55].

Herstellung der Ausgangsstoffe der Formel (VIII)

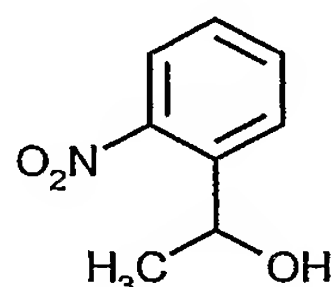
10 Beispiel (VIII-1)



In einem 6 Liter-Dreihalskolben mit Rührer, Tropftrichter und Thermometer werden 311 g 1-(2-Nitrophenyl)ethanol (XI-1) (Gehalt 95,8 %, 1,78 mol) in 3000 ml Dimethylformamid gelöst. Unter Rühren werden in einer Portion 921,4 g (7,13 mol) Diisopropylethylamin zugegeben, 5 Minuten gerührt und bei guter Kühlung in einem Temperaturbereich zwischen 20 und 35°C 612,5 g (5,35 mol) Methansulfonsäurechlorid zugetropft. Nach Abklingen der Reaktion wird noch 90 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, unter Vakuum das Lösungsmittel entfernt, in Essigsäureethylester aufgenommen, 3 mal mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch gereinigt (Kieselgel, Hexan/Aceton 9:1). Man erhält 219 g (Gehalt 100 %, HPLC, 66,2 % der Theorie) an 1-(1-Chlorethyl)-2-nitrobenzol in Form eines bräunlichen Öls [logP (pH 2,3) = 2,87].

Herstellung der Ausgangsstoffe der Formel (XI)

25 Beispiel (XI-1)



In einem 6-Liter Dreihalskolben mit Rührer, Tropftrichter, Thermometer und Blasenähler werden 320 g (1,938 mol) 2-Nitroacetophenon in 3200 ml Methanol vorgelegt und unter schwacher Kühlung bei 30-40°C eine Lösung von 73,3 g (1,938 mol) Natriumborhydrid in 288 ml Wasser zugetropft. Nach Abklingen der Reaktion wird noch 16 Stunden bei Raumtemperatur nachgerührt. Zur Aufarbeitung wird mit verdünnter Salzsäure neutralisiert und das Lösungsmittel am Rotationsverdampfer ab-

gezogen. Der verbliebene Rückstand wird mit Dichlormethan aufgenommen, mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Man erhält 311 g (Gehalt 95,1 %, HPLC, 91,3 % der Theorie) von 1-(2-Nitrophenyl)ethanol [$\log P$ (pH 2,3) = 1,49] in Form eines hellen Öls.

5

Die Bestimmung der angegebenen $\log P$ -Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

- 10 Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich (pH 2,3): 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.

Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren $\log P$ -Werte bekannt sind (Bestimmung der $\log P$ -Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

- 15 Die λ -max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Anwendungsbeispiele

Beispiel A

5 **Podospaera-Test (Apfel) / protektiv**

Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton
 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykoether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension des Apfelmehltauerregers *Podospaera leucotricha* inokuliert. Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 23°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 70 % aufgestellt.

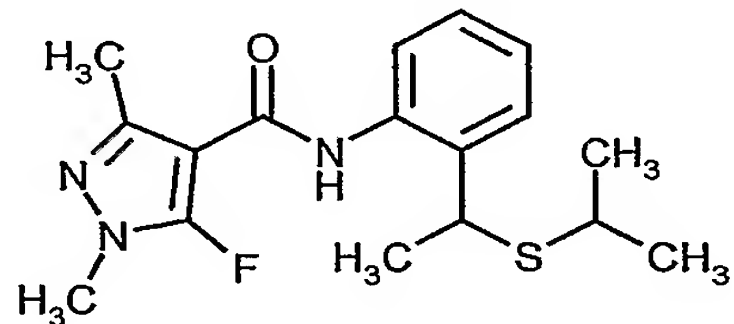
20

10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Tabelle A

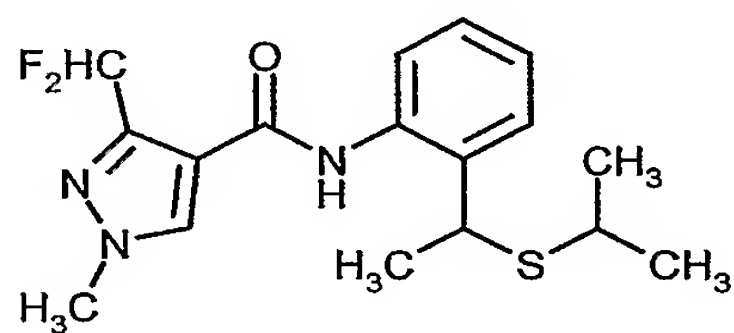
Podospaera-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
------------------------------	--------------------------------------	----------------------



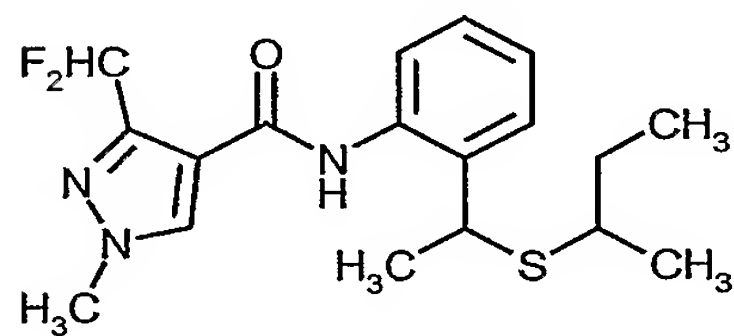
100

91



100

84



100

94

Beispiel B**Venturia - Test (Apfel) / protektiv**

- 5 Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton
 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers *Venturia inaequalis* inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90 % aufgestellt.

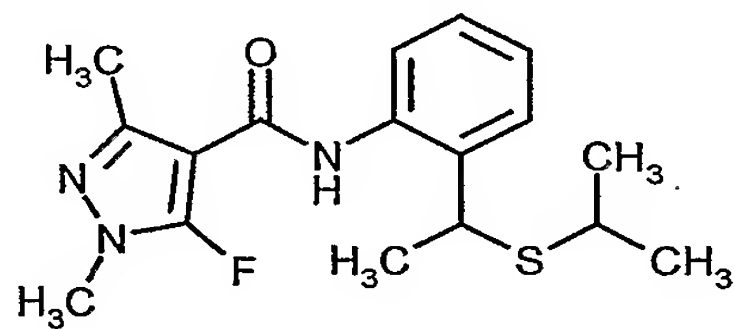
20

10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Tabelle B

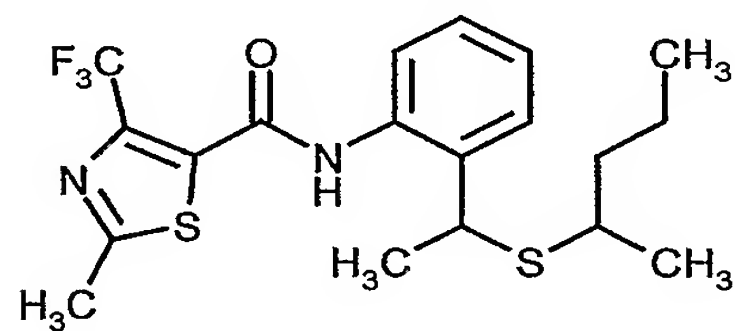
Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
------------------------------	--------------------------------------	----------------------



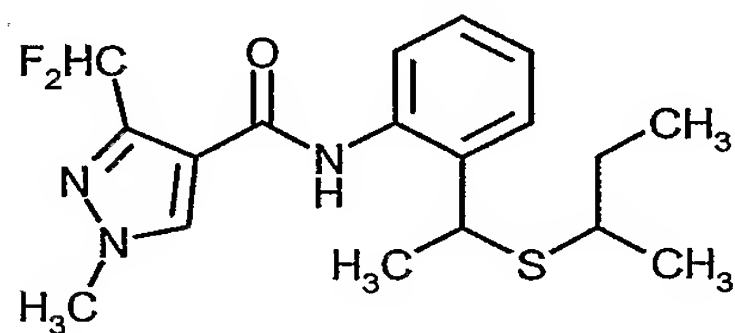
100

95



100

89



100

99

Beispiel C**Botrytis - Test (Bohne) / protektiv**

- 5 Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton
 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykoether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

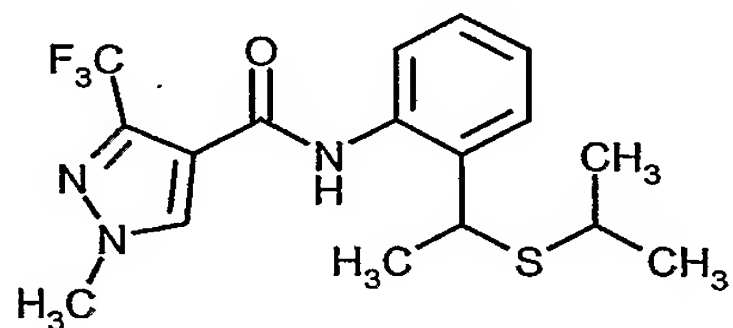
15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden auf jedes Blatt 2 kleine mit Botrytis cinerea bewachsene Agarstückchen aufgelegt. Die inokulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten Kammer bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt.

20 2 Tage nach der Inokulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Tabelle C

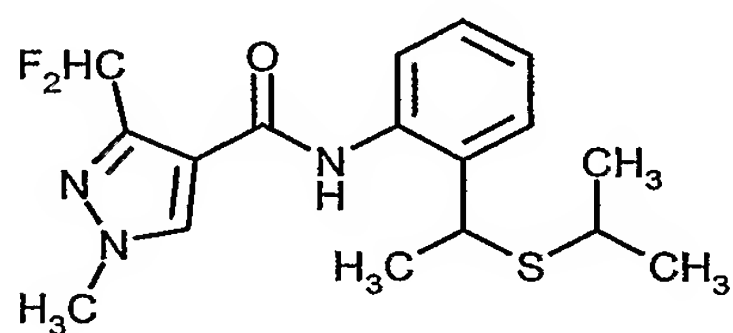
Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
------------------------------	--------------------------------------	----------------------



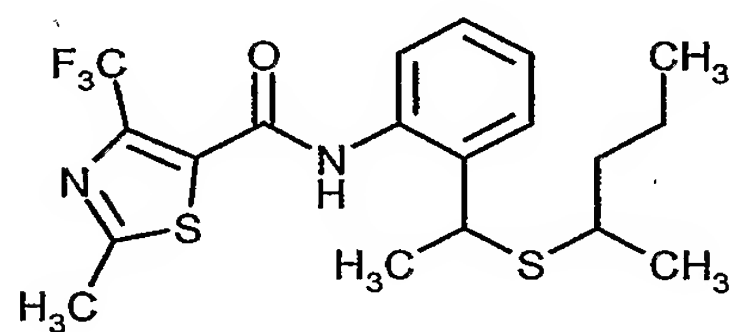
500

84



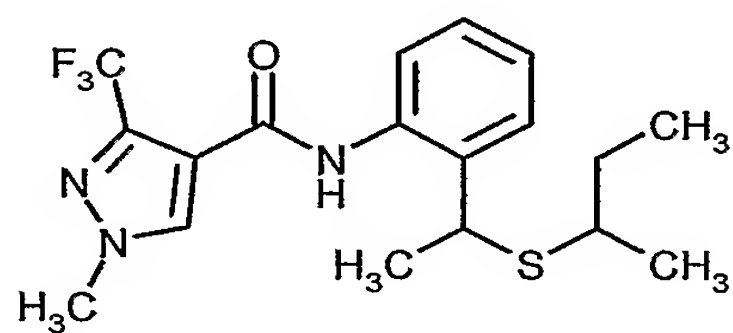
500

100



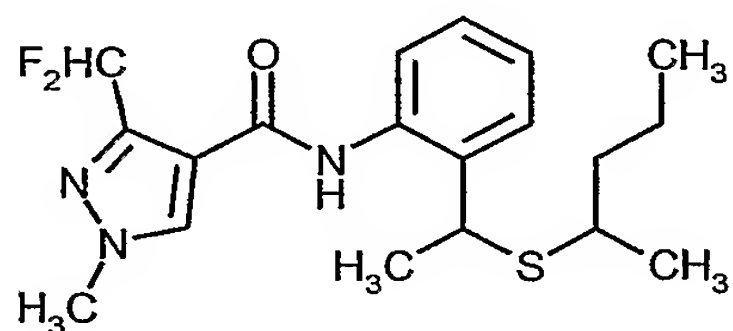
500

99



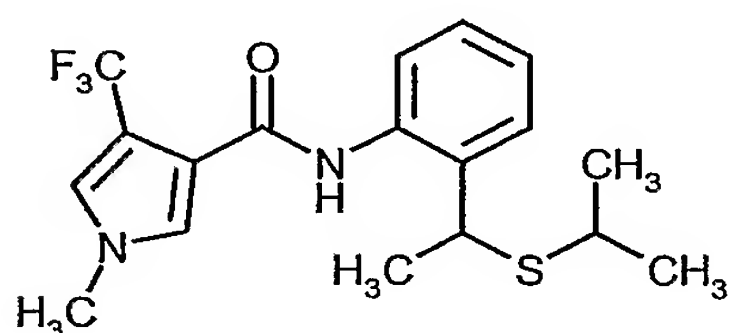
500

100



500

97



500

97

Beispiel D**Puccinia-Test (Weizen) / protektiv**

- 5 Lösungsmittel: 50 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid
 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser
10 auf die gewünschte Konzentration.

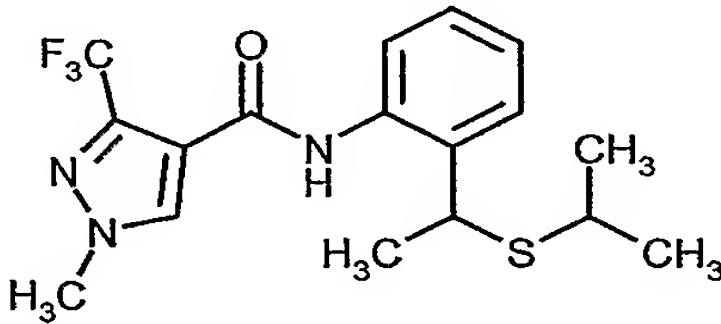
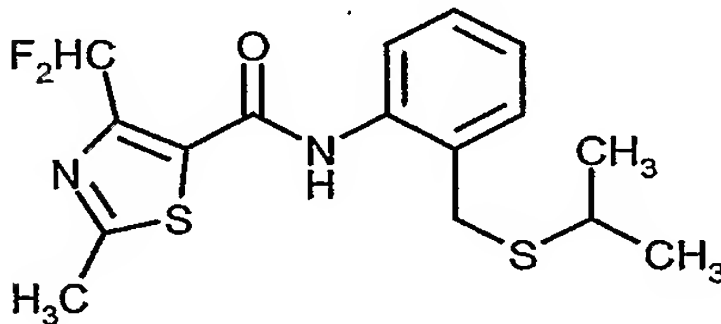
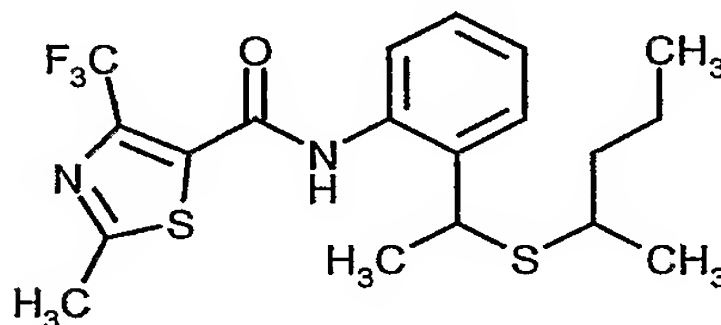
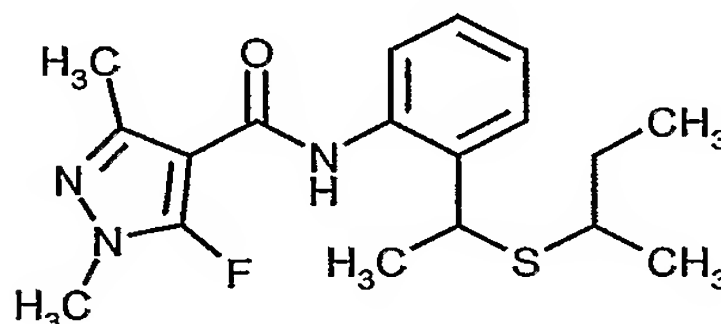
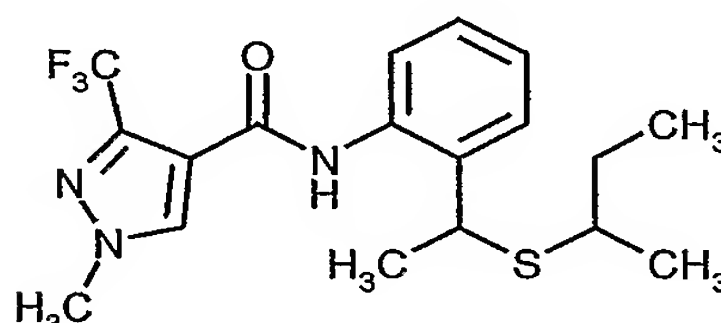
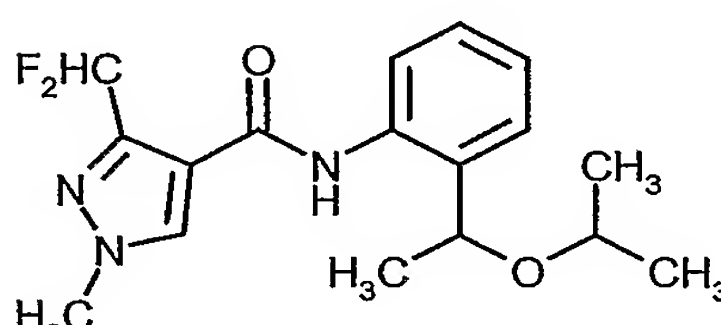
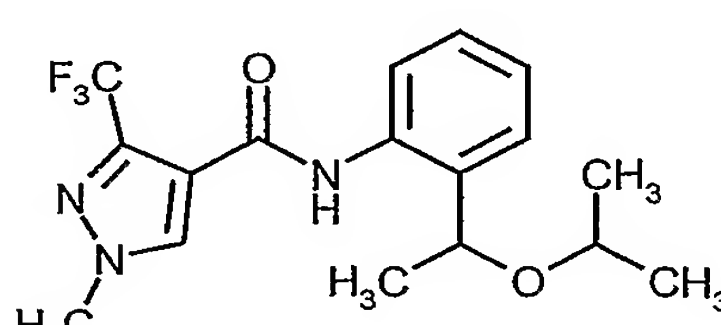
Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer Konidiensuspension von *Puccinia recondita* besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei
15 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden dann in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 80 % aufgestellt, um die Entwicklung von Rostpusteln zu begünstigen.

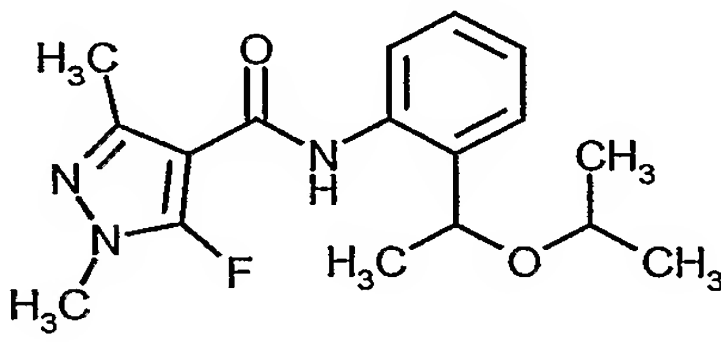
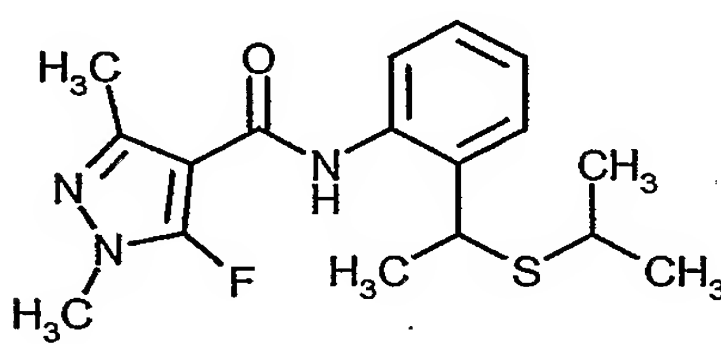
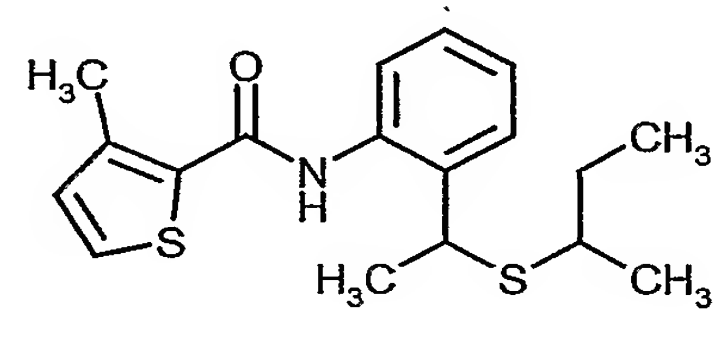
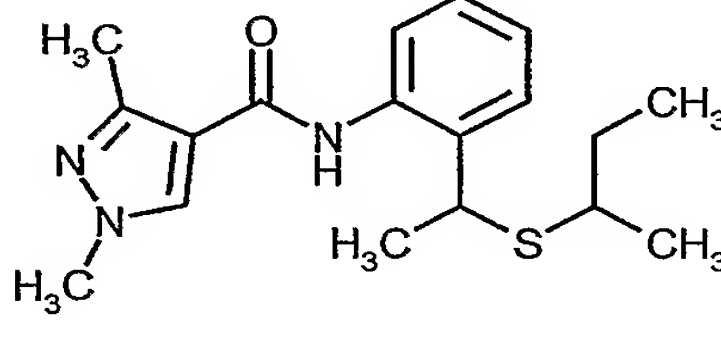
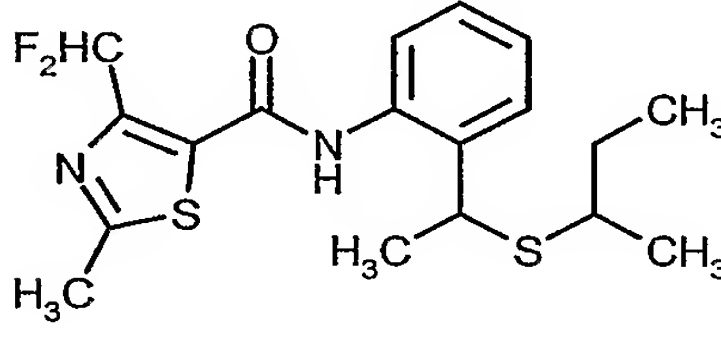
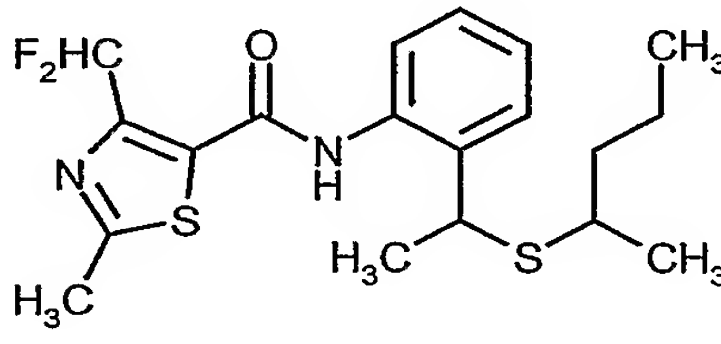
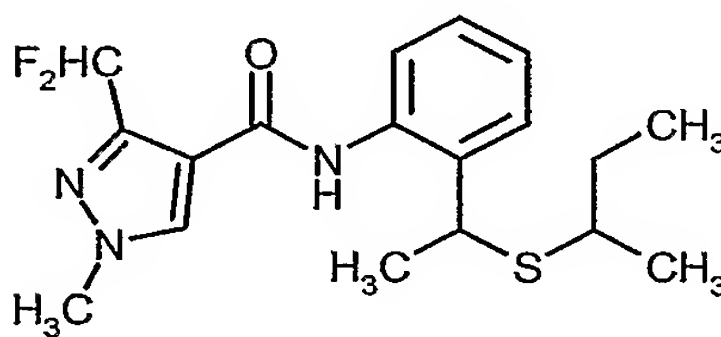
20 10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Tabelle D

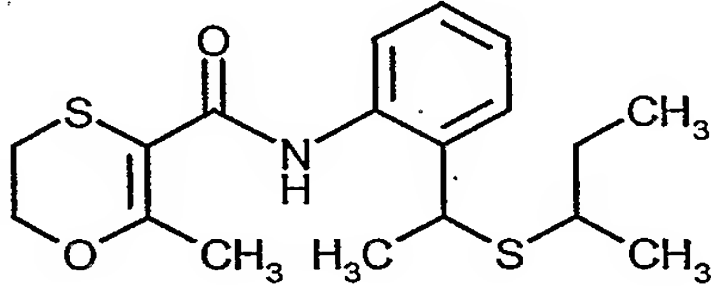
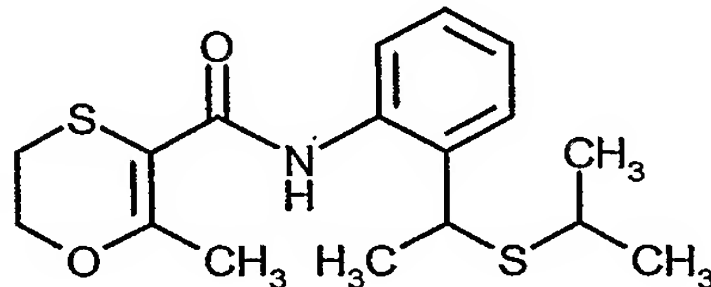
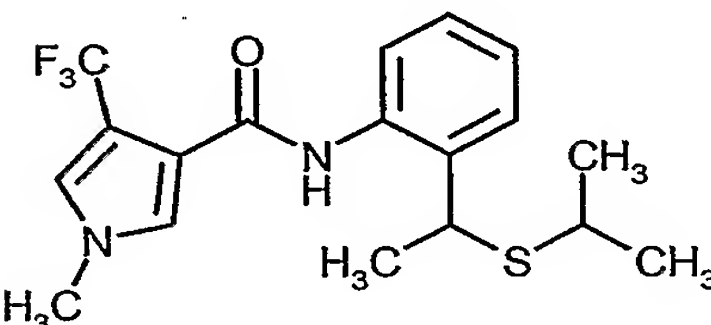
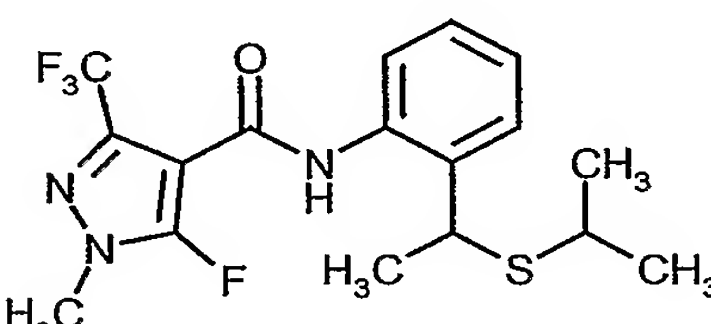
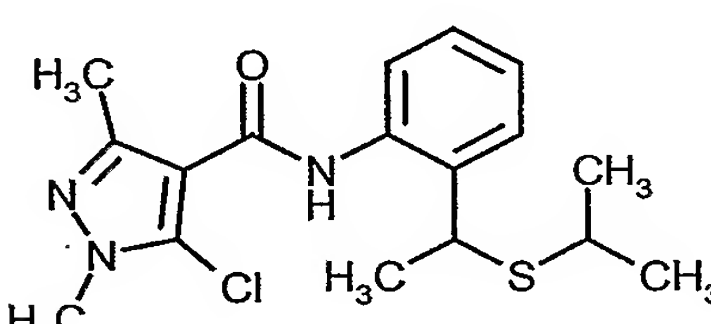
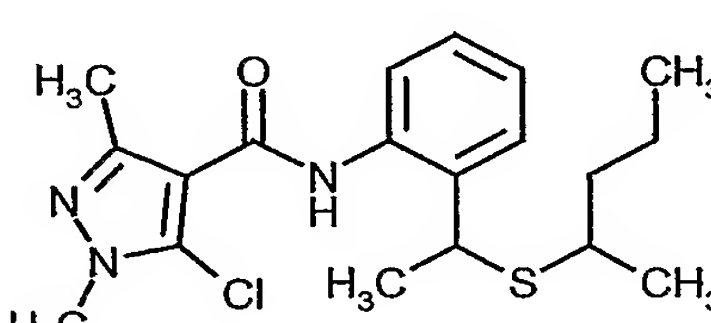
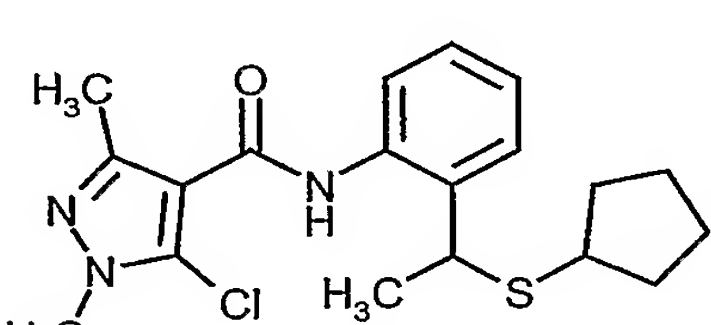
Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	500	100
	500	93
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	500	100
	500	100
	500	100
	500	96
	500	100
	500	100
	500	100

Beispiel E**Alternaria-Test (Tomate) / protektiv**

- 5 Lösungsmittel: 49 Gewichtsteile N,N-Dimethylformamid
 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolglykoether

 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser
10 auf die gewünschte Konzentration.

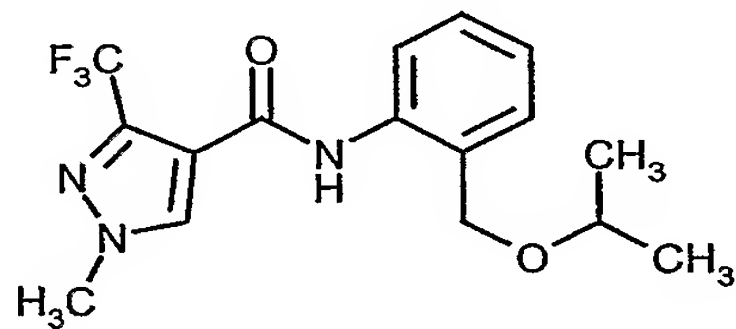
 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Tomatenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Alternaria solani* inokuliert und stehen dann 24 h bei 100 % relativer
15 Feuchte und 20°C. Anschließend stehen die Pflanzen bei 96 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 20°C.

 7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein
20 Befall beobachtet wird.

Tabelle E

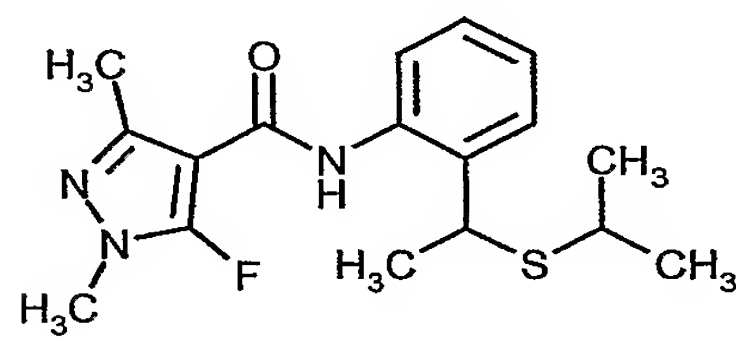
Alternaria-Test (Tomate) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
------------------------------	--------------------------------------	----------------------



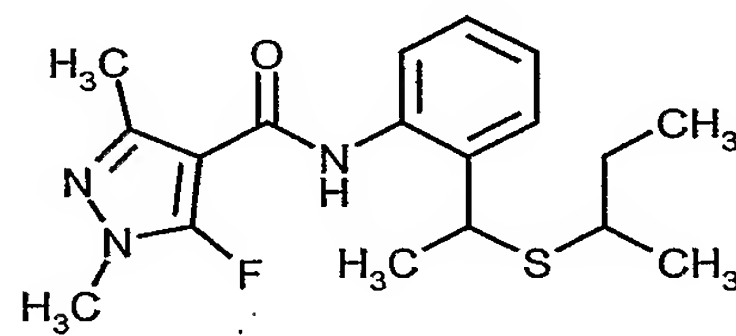
750

95



750

90

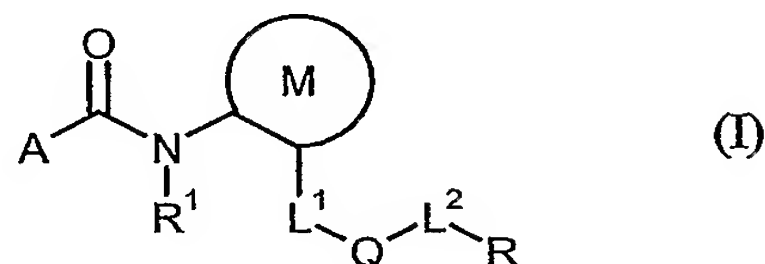


750

95

Patentansprüche

1. Carboxamide der Formel (I)



5 in welcher

- R¹ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; (C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R², -CONR³R⁴ oder -CH₂NR⁵R⁶ steht,
- R² für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,
- R³ und R⁴ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- R³ und R⁴ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR⁷ enthalten kann,
- R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- R⁵ und R⁶ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden,

wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^7 enthalten kann,

R^7 für Wasserstoff oder C_1 - C_6 -Alkyl steht,

M für einen jeweils einfach durch R^8 substituierten Phenyl-, Pyridin- oder Pyrimidin-, Pyridazin oder Pyrazin-Ring oder für einen durch R^{8-A} substituierten Thiazol-Ring steht,

R^8 für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

R^8 außerdem für Methoxy steht,

R^{8-A} für Wasserstoff, Methyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

L^1 für C_1 - C_{10} -Alkylen (Alkandiyl) steht,

Q für O, S, SO, SO_2 oder NR^9 steht,

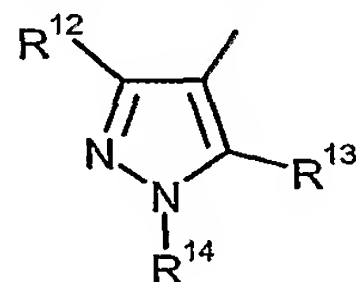
L^2 für eine direkte Bindung, $\text{SiR}^{10}\text{R}^{11}$ oder CO steht,

R für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkinyl oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl steht,

R^9 für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkinyl oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl steht,

R^{10} und R^{11} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl oder C_1 - C_6 -Halogenalkyl stehen,

A für den Rest der Formel (A1)



(A1) steht, in welcher

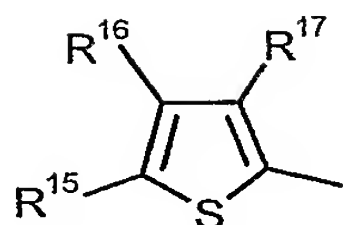
R^{12} für Wasserstoff, Cyano, Halogen, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy oder C_1 - C_4 -Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, Aminocarbonyl oder Aminocarbonyl- C_1 - C_4 -alkyl steht,

R^{13} für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Alkylthio steht,

R^{14} für Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl, Hydroxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_4 -Alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy- C_1 - C_4 -alkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, oder Phenyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A2)

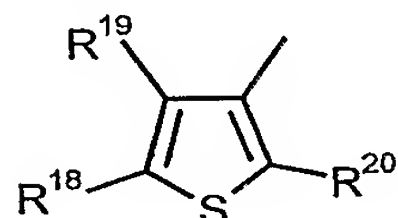


(A2) steht, in welcher

R¹⁵ und R¹⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,
 R¹⁷ für Halogen, Cyano oder C₁-C₄-Alkyl, oder C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A3)

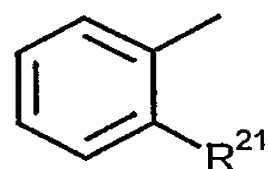


(A3) steht, in welcher

R¹⁸ und R¹⁹ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,
 R²⁰ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)

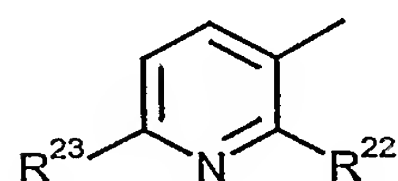


(A4) steht, in welcher

R²¹ für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)



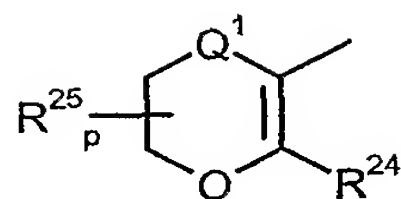
(A5) steht, in welcher

R²² für Halogen, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R²³ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, C₁-C₄-Alkylsulphinyl oder C₁-C₄-Alkylsulphonyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A6)



(A6) steht, in welcher

R^{24} für C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

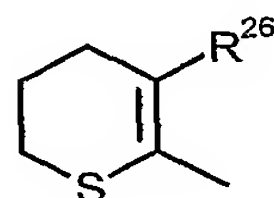
R^{25} für C_1 - C_4 -Alkyl steht,

Q^1 für S (Schwefel), SO, SO_2 oder CH_2 steht,

p für 0, 1 oder 2, wobei R^{25} für identische oder verschiedene Reste steht, wenn p für 2 steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)

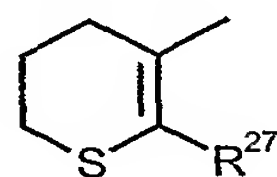


(A7) steht, in welcher

R^{26} für C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A8)

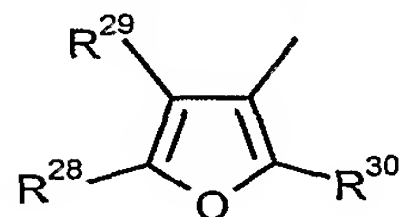


(A8) steht, in welcher

R^{27} für C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A9)



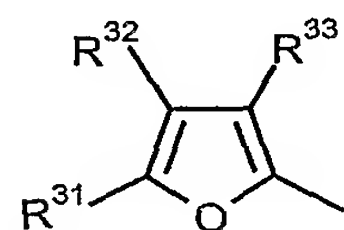
(A9) steht, in welcher

R^{28} und R^{29} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen,

R^{30} für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)



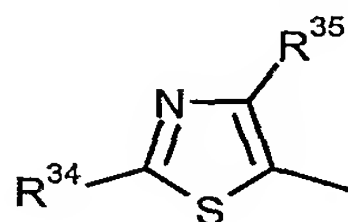
(A10) steht, in welcher

R^{31} und R^{32} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen,

R^{33} für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



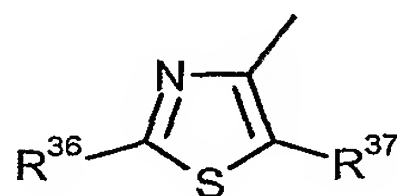
(A11) steht, in welcher

R^{34} für Wasserstoff, Halogen, Amino, C_1 - C_4 -Alkylamino, Di- $(C_1$ - C_4 -alkyl)amino, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{35} für Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A12)



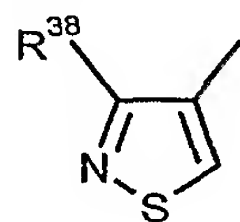
(A12) steht, in welcher

R^{36} für Wasserstoff, Halogen, Amino, C_1 - C_4 -Alkylamino, Di- $(C_1$ - C_4 -alkyl)amino, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{37} für Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A13)

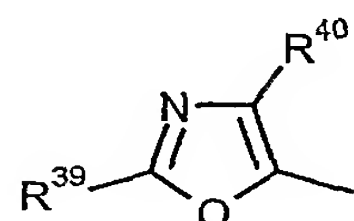


(A13) steht, in welcher

R^{38} für Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A14)



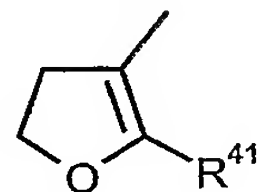
(A14) steht, in welcher

R^{39} für Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl steht,

R^{40} für Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A15)



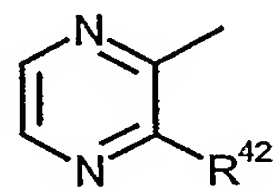
(A15) steht, in welcher

R^{41} für C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

5

oder

A für den Rest der Formel (A16)



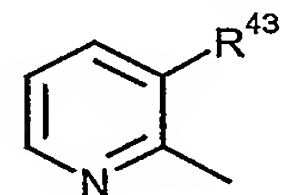
(A16) steht, in welcher

R^{42} für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

10

oder

A für den Rest der Formel (A17)



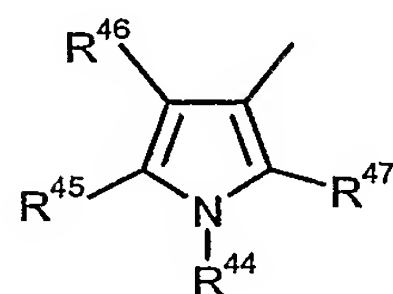
(A17) steht, in welcher

R^{43} für Halogen, Hydroxy, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio oder C_1 - C_4 -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

15

oder

A für den Rest der Formel (A18)



(A18) steht, in welcher

R^{44} für Wasserstoff, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, Hydroxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, Di(C_1 - C_4 -alkyl)aminosulfonyl, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylsulfonyl oder Benzoyl steht,

20

R^{45} für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

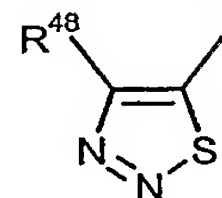
25

R^{46} für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{47} für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A19)



(A19) steht, in welcher

R^{48} für C_1 - C_4 -Alkyl steht.

5

2. Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher R nicht für Alkoxy steht, wenn L^2 für eine direkte Bindung steht.

3. Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2, in welcher

10

R^1 für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_8 -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- C_1 - C_3 -alkyl, (C_1 - C_3 -Alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, (C_1 - C_3 -Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl; Halogen-(C_1 - C_3 -alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, Halogen-(C_1 - C_3 -alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; (C_1 - C_6 -Alkyl)carbonyl, (C_1 - C_4 -Alkoxy)carbonyl, (C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl)carbonyl, (C_3 - C_6 -Cycloalkyl)carbonyl; (C_1 - C_4 -Halogenalkyl)carbonyl, (C_1 - C_4 -Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl)carbonyl, (C_3 - C_6 -Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ oder $-CH_2NR^5R^6$ steht,

15

R^2 für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, Halogen- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

25

R^3 und R^4 unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_4 -Halogenalkyl, Halogen- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R^3 und R^4 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^7 enthalten kann,

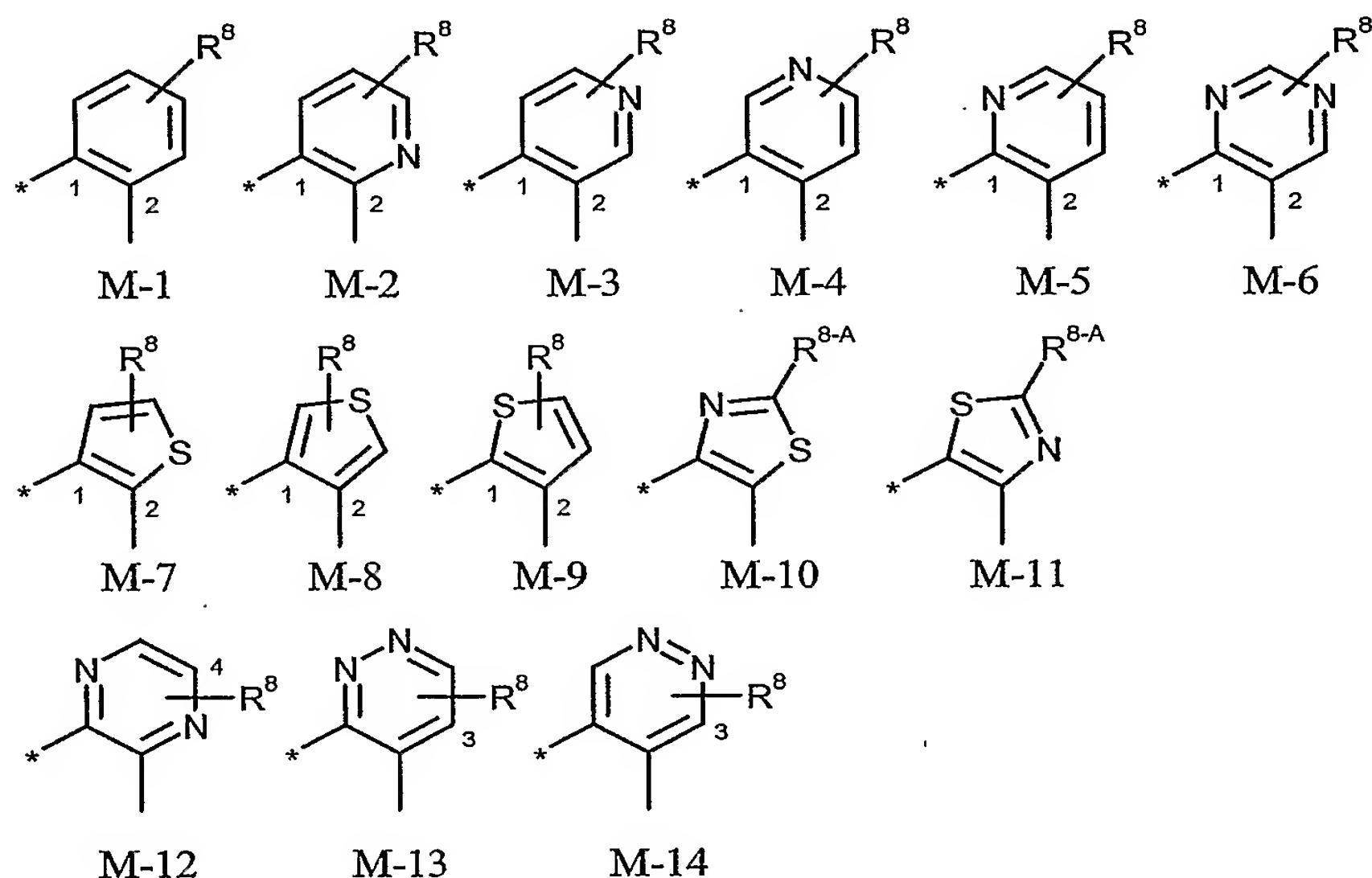
30

R^5 und R^6 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_3 - C_6 -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R^5 und R^6 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^7 enthalten kann,

R^7 für Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl steht,

M für einen der folgenden Cyclen steht



wobei die mit „*“ markierte Bindung mit dem Amid verknüpft ist,

R^8 für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

R^8 außerdem für Methoxy steht,

R^{8-A} für Wasserstoff, Methyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

L^1 für C_1 - C_{10} -Alkylen (Alkandiyl) steht,

Q für O, S, SO, SO_2 oder NR^9 steht,

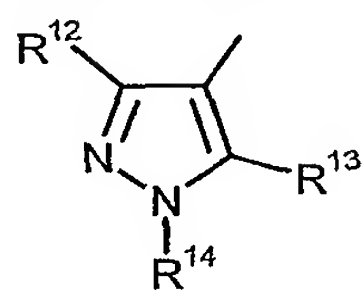
L^2 für eine direkte Bindung, $SiR^{10}R^{11}$ oder CO steht,

R für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_1 - C_3 -Alkylthio- C_1 - C_3 -alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl steht,

R^9 für Wasserstoff C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_1 - C_3 -Alkylthio- C_1 - C_3 -alkyl oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl steht,

R^{10} und R^{11} unabhängig voneinander für C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl oder C_1 - C_3 -Alkylthio- C_1 - C_3 -alkyl stehen,

A für den Rest der Formel (A1),



(A1) steht, in welcher

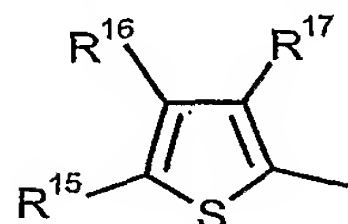
5 R^{12} für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Cyclopropyl, C_1 - C_2 -Halogenalkyl, C_1 - C_2 -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Aminocarbonyl, Aminocarbonylmethyl oder Aminocarbonylethyl steht,

R^{13} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio oder Ethylthio steht,

10 R^{14} für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder Phenyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A2)



(A2) steht, in welcher

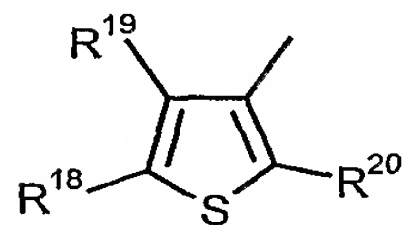
15

R^{15} und R^{16} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

20 R^{17} für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, C_1 - C_2 -Halogenalkyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A3)



(A3) steht, in welcher

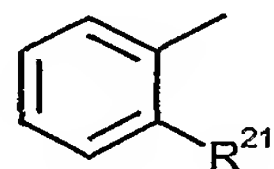
25

R^{18} und R^{19} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

R^{20} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)

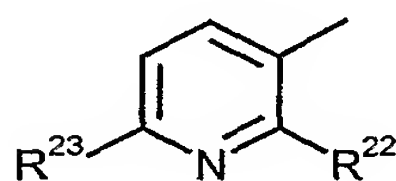


(A4) steht, in welcher

R²¹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)



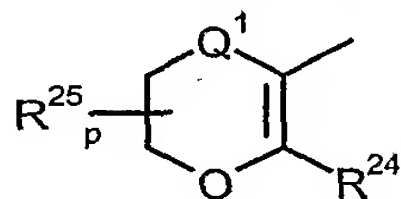
(A5) steht, in welcher

R²² für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

R²³ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, C₁-C₂-Alkylsulphanyl oder C₁-C₂-Alkylsulphonyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A6)



(A6) steht, in welcher

R²⁴ für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

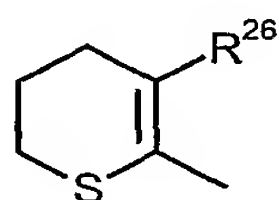
R²⁵ für Methyl oder Ethyl steht,

Q¹ für S (Schwefel), SO₂ oder CH₂ steht,

p für 0 oder 1 steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)

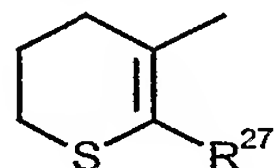


(A7) steht, in welcher

R^{26} für Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A8)

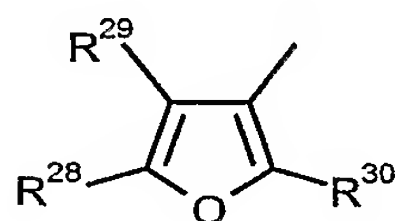


(A8) steht, in welcher

R^{27} für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A9)



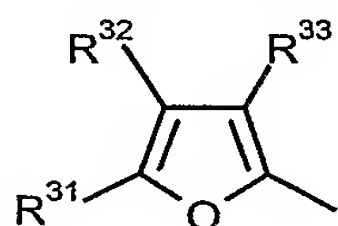
(A9) steht, in welcher

R^{28} und R^{29} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen stehen,

R^{30} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)



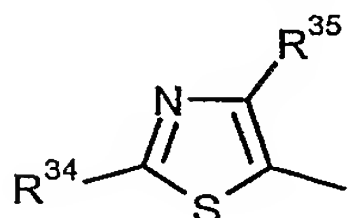
(A10) steht, in welcher

R^{31} und R^{32} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Nitro, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen stehen,

R^{33} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



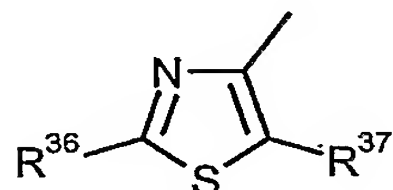
(A11) steht, in welcher

R^{34} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C_1 - C_4 -Alkylamino, Di(C_1 - C_4 -alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

R^{35} für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A12)



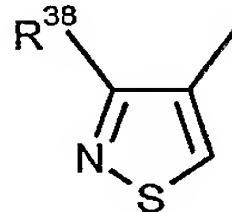
(A12) steht, in welcher

R^{36} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C_1 - C_4 -Alkylamino, Di(C_1 - C_4 -alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

R^{37} für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A13)

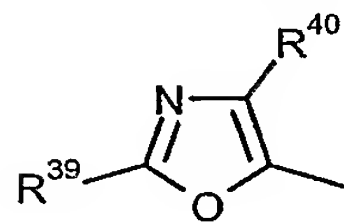


(A13) steht, in welcher

R^{38} für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A14)



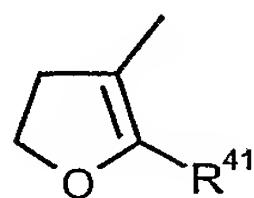
(A14) steht, in welcher

R^{39} für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht,

R^{40} für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A15)

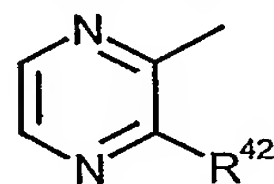


(A15) steht, in welcher

R^{41} für Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A16)



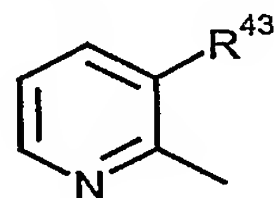
(A16) steht, in welcher

R^{42} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

5

oder

A für den Rest der Formel (A17)



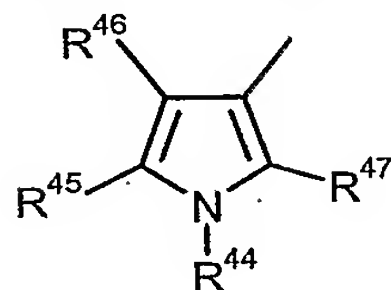
(A17) steht, in welcher

R^{43} für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, C_1 - C_4 -Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C_1 - C_2 -Halogenalkyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

10

oder

A für den Rest der Formel (A18)



(A18) steht, in welcher

R^{44} für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C_1 - C_2 -Alkoxy- C_1 - C_2 -alkyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Methylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,

R^{45} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

20

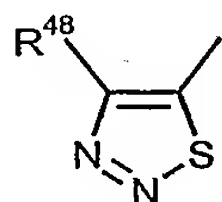
R^{46} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R^{47} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

25

oder

A für den Rest der Formel (A19)

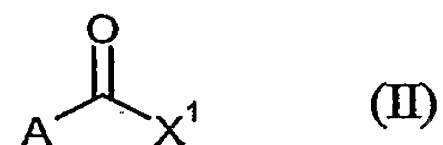


(A19) steht, in welcher

R^{48} für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder iso-Propyl steht.

4. Verfahren zum Herstellen der Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

- 5 (a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)

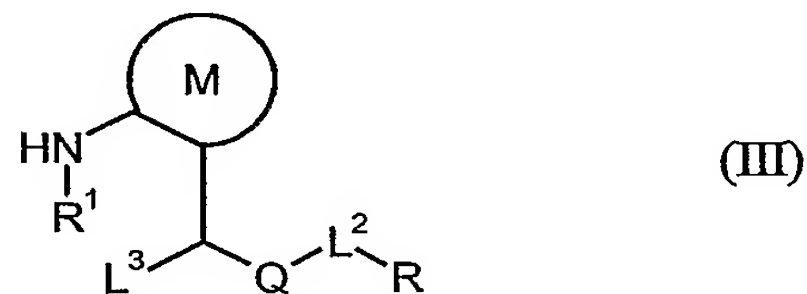


in welcher

A die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X^1 für Halogen oder Hydroxy steht,

- 10 mit Anilin-Derivaten der Formel (III)



in welcher

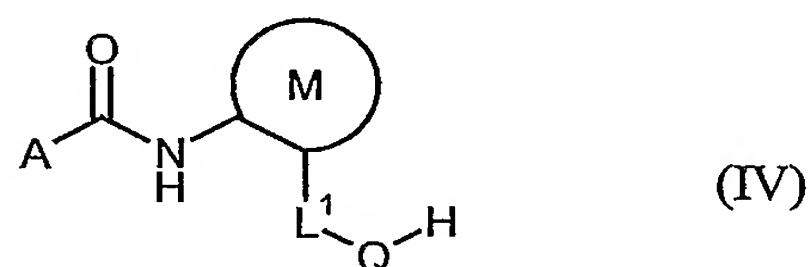
R^1 , M, Q, L^2 und R die oben angegebenen Bedeutungen haben,

L^3 für Wasserstoff oder C_1 - C_9 -Alkyl steht,

- 15 gegebenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder

- (b) Carboxamide der Formel (IV)



20

in welcher M, L^1 , Q und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,
mit einer Verbindung der Formel (V)



in welcher

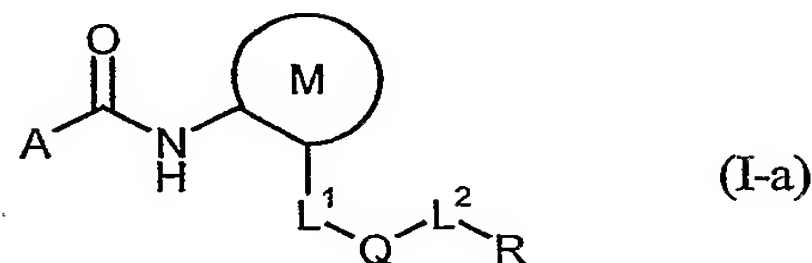
- 25 L^2 und R die oben angegebenen Bedeutungen haben,

Y für Halogen, Triflat (Trifluormethylsulfonyl), Mesylat (Methylsulfonyl) oder Tosylat (4-Methylphenylsulfonyl) steht,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder

(c) Carboxamide der Formel (I-a)



in welcher M, L¹, Q, L², R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,
mit Halogeniden der Formel (VI)



in welcher

X² für Chlor, Brom oder Iod steht,

R^{1-A} für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)-carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
(C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R², -CONR³R⁴ oder -CH₂NR⁵R⁶ steht,

wobei R², R³, R⁴, R⁵ und R⁶ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

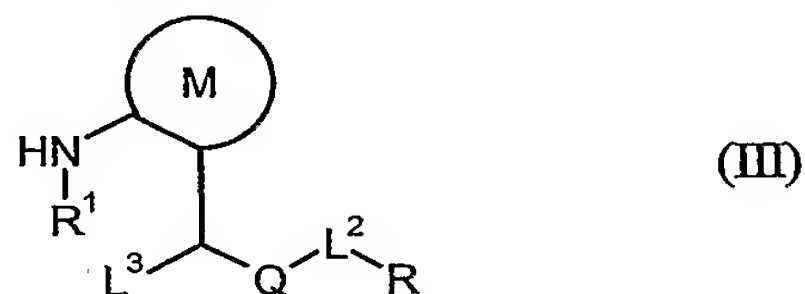
in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

5. Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Carboxamid der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.
6. Verwendung von Carboxamiden der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen.

7. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.

5 8. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

9. Anilin-Derivaten der Formel (III)



10

in welcher

R¹, M, Q, L² und R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

L³ für Wasserstoff oder C₁-C₉-Alkyl steht.

15

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/000633

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 A01N43/56 C07D231/16 C07D231/14

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 A01N C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 03/010149 A (BAYER) 6 February 2003 (2003-02-06) cited in the application page 1, paragraph 1 Seiten 63-66, Zwischenprodukte claim 1 -----	1-9
X	DIXON ET AL: "Kinetics and mechanism of the addition of water and ring-opening of 2-methyl- and 2-aryl-4H-3,1-benzoxazines to 2-aminobenzyl esters in the acidic pH range; change in rate-limiting step with buffer concentration and evidence for a tetrahedral carbonyl addition intermediate" J. CHEM. SOC. PERKIN TRANS. 2, vol. 8, 1997, pages 1503-1509, XP002323920 (2-hydroxymethyl-anilide) benzoic acid ----- -/--	1-8

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

° Special categories of cited documents :

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *&* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

19 April 2005

Date of mailing of the international search report

02/05/2005

Name and mailing address of the ISA
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Cortés, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/000633

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>RAIFORD ET AL: "BEHAVIOR OF MIXED O-ACYL-N-ACYL DERIVATIVES IN WHICH THE REACTING GROUPS ARE NOT ON ADJACENT CARBON ATOMS" J. AM. CHEM. SOC., vol. 48, 1926, pages 483-489, XP002323921 page 487; compounds</p> <p style="text-align: center;">-----</p>	1-8
X	<p>DATABASE BEILSTEIN 29 June 1989 (1989-06-29), XP002323927 Database accession no. BRN: 1216128 CAS Registry Number: 51489-16-8 Chemical Name: 2-Benzoylamido-6-chlor-benzylalkohol abstract & ASAKAWA ET AL: CHEM. PHARM. BULL., vol. 27, 1979, pages 522-527, & weitere Verbindungen, z.B.: 2-(2'-Thienylamino)-5-chlor-benzylalkohol</p> <p style="text-align: center;">-----</p>	1-8
X	<p>DATABASE BEILSTEIN 5 February 1990 (1990-02-05), XP002323928 Database accession no. BRN: 3325417 CAS Registry Number: 75541-90-1 Chemical Name: benzoic acid-(2-methoxymethyl-anilide) abstract & CLOVER ET AL: J. CHEM. SOC. PERKIN TRANS. 2, vol. 7, 1996, pages 1367-1376, & weitere Verbindungen, z.B.:</p> <p style="text-align: center;">-----</p>	1-8
X	<p>DATABASE BEILSTEIN 25 July 2003 (2003-07-25), XP002323929 Database accession no. BRN: 9326393 Chemical Name: furan-2-carboxylic acid (2-hydroxymethyl-phenyl)-amide abstract & MISHIO ET AL: HETEROCYCLES, vol. 58, 2002, pages 203-212,</p> <p style="text-align: center;">-----</p>	1-8
X	<p>BELEKON ET AL: "Synthesis of -Amino Acids via Asymmetric Phase Transfer-Catalyzed Alkylation of Achiral Nickel(II) Complexes of Glycine-Derived Schiff Bases" J. AM. CHEM. SOC., vol. 125, no. 42, 2003, pages 12860-12871, XP002323922 pyridine-2-carboxylic acid(2-hydroxymethylphenyl)amide</p> <p style="text-align: center;">-----</p> <p style="text-align: center;">-/--</p>	1-8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP2005/000633

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CHAN SIK CHO ET AL: "Ruthenium-catalyzed oxidative coupling and cyclization between 2-aminobenzyl alcohol and secondary alcohols leading to quinolines" TETRAHEDRON, vol. 59, no. 40, 2003, pages 7997-8002, XP002323923 compound 1	9
X	----- ROUSSEL ET AL: "Inhibition of the tissue factor/factor VIIa complex ? Lead optimisation using combinatorial chemistry" TETRAHEDRON, vol. 55, no. 19, 1999, pages 6219-6230, XP002323924 2-amino-5-methyl-benzyl alcohol 2-amino-3-methyl-benzyl alcohol	9
X	----- TSOUNGAS ET AL: "A convenient access to benzo-substituted phthalazines as potential precursors to DNA intercalators" TETRAHEDRON LETTERS, vol. 42, no. 37, 2001, pages 6589-6592, XP002323925 compound 2	9
X	----- MULZER ET AL: "Chiral Acetals as Stereoinductors: Diastereoface Selective Alkylation of Dihydrobenzoxazine-Derived Amide Enolates" J. ORG. CHEM., vol. 65, no. 20, 2000, pages 6540-6546, XP002323926 tert-butyl(2-aminobenzyl-oxy)dimethylsilane	9
P,X	----- JP 2004 189738 A (NIPPON NOHYAKU) 8 July 2004 (2004-07-08) the whole document	1-9

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/000633

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 03010149	A	06-02-2003	DE 10136065 A1	13-02-2003
			BR 0211482 A	17-08-2004
			CN 1533380 A	29-09-2004
			WO 03010149 A1	06-02-2003
			EP 1414803 A1	06-05-2004
			HU 0401478 A2	29-11-2004
			JP 2005501044 T	13-01-2005
			MX PA04000622 A	20-04-2004
			US 2004204470 A1	14-10-2004
<hr/>				
JP 2004189738	A	08-07-2004	NONE	
<hr/>				

INTERNATIONAL RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/000633

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 A01N43/56 C07D231/16 C07D231/14

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A01N C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 03/010149 A (BAYER) 6. Februar 2003 (2003-02-06) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Absatz 1 Seiten 63-66, Zwischenprodukte Anspruch 1 -----	1-9
X	DIXON ET AL: "Kinetics and mechanism of the addition of water and ring-opening of 2-methyl- and 2-aryl-4H-3,1-benzoxazines to 2-aminobenzyl esters in the acidic pH range; change in rate-limiting step with buffer concentration and evidence for a tetrahedral carbonyl addition intermediate" J. CHEM. SOC. PERKIN TRANS. 2, Bd. 8, 1997, Seiten 1503-1509, XP002323920 (2-hydroxymethyl-anilide) benzoic acid ----- -/--	1-8



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

° Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

19. April 2005

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

02/05/2005

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Cortés, J

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>RAIFORD ET AL: "BEHAVIOR OF MIXED O-ACYL-N-ACYL DERIVATIVES IN WHICH THE REACTING GROUPS ARE NOT ON ADJACENT CARBON ATOMS"</p> <p>J. AM. CHEM. SOC., Bd. 48, 1926, Seiten 483-489, XP002323921 Seite 487; Verbindungen</p> <p>-----</p>	1-8
X	<p>DATABASE BEILSTEIN</p> <p>29. Juni 1989 (1989-06-29), XP002323927 Database accession no. BRN: 1216128 CAS Registry Number: 51489-16-8 Chemical Name: 2-Benzoylamido-6-chlor-benzylalkohol Zusammenfassung & ASAKAWA ET AL: CHEM. PHARM. BULL., Bd. 27, 1979, Seiten 522-527, & weitere Verbindungen, z.B.: 2-(2'-Thienylamino)-5-chlor-benzylalkohol</p> <p>-----</p>	1-8
X	<p>DATABASE BEILSTEIN</p> <p>5. Februar 1990 (1990-02-05), XP002323928 Database accession no. BRN: 3325417 CAS Registry Number: 75541-90-1 Chemical Name: benzoic acid-(2-methoxymethyl-anilide) Zusammenfassung & CLOVER ET AL: J. CHEM. SOC. PERKIN TRANS. 2, Bd. 7, 1996, Seiten 1367-1376, & weitere Verbindungen, z.B.:</p> <p>-----</p>	1-8
X	<p>DATABASE BEILSTEIN</p> <p>25. Juli 2003 (2003-07-25), XP002323929 Database accession no. BRN: 9326393 Chemical Name: furan-2-carboxylic acid (2-hydroxymethyl-phenyl)-amide Zusammenfassung & MISHIO ET AL: HETEROCYCLES, Bd. 58, 2002, Seiten 203-212,</p> <p>-----</p>	1-8
X	<p>BELEKON ET AL: "Synthesis of -Amino Acids via Asymmetric Phase Transfer-Catalyzed Alkylation of Achiral Nickel(II) Complexes of Glycine-Derived Schiff Bases"</p> <p>J. AM. CHEM. SOC., Bd. 125, Nr. 42, 2003, Seiten 12860-12871, XP002323922 pyridine-2-carboxylic acid(2-hydroxymethylphenyl)amide</p> <p>-----</p>	1-8

-/--

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>CHAN SIK CHO ET AL: "Ruthenium-catalyzed oxidative coupling and cyclization between 2-aminobenzyl alcohol and secondary alcohols leading to quinolines"</p> <p>TETRAHEDRON, Bd. 59, Nr. 40, 2003, Seiten 7997-8002, XP002323923 Verbindung 1</p>	9
X	<p>ROUSSEL ET AL: "Inhibition of the tissue factor/factor VIIa complex ? Lead optimisation using combinatorial chemistry"</p> <p>TETRAHEDRON, Bd. 55, Nr. 19, 1999, Seiten 6219-6230, XP002323924 2-amino-5-methyl-benzyl alcohol 2-amino-3-methyl-benzyl alcohol</p>	9
X	<p>TSOUNGAS ET AL: "A convenient access to benzo-substituted phthalazines as potential precursors to DNA intercalators"</p> <p>TETRAHEDRON LETTERS, Bd. 42, Nr. 37, 2001, Seiten 6589-6592, XP002323925 Verbindung 2</p>	9
X	<p>MULZER ET AL: "Chiral Acetals as Stereoinductors: Diastereoface Selective Alkylation of Dihydrobenzoxazine-Derived Amide Enolates"</p> <p>J. ORG. CHEM., Bd. 65, Nr. 20, 2000, Seiten 6540-6546, XP002323926 tert-butyl(2-aminobenzyl oxy)dimethylsilane</p>	9
P, X	<p>JP 2004 189738 A (NIPPON NOHYAKU) 8. Juli 2004 (2004-07-08) das ganze Dokument</p>	1-9

INTERNATIONALE RESEARCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/000633

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 03010149	A	06-02-2003	DE 10136065 A1 13-02-2003
			BR 0211482 A 17-08-2004
			CN 1533380 A 29-09-2004
			WO 03010149 A1 06-02-2003
			EP 1414803 A1 06-05-2004
			HU 0401478 A2 29-11-2004
			JP 2005501044 T 13-01-2005
			MX PA04000622 A 20-04-2004
			US 2004204470 A1 14-10-2004
JP 2004189738	A	08-07-2004	KEINE